

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2003 年12 月24 日 (24.12.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/106689 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C12P 13/12, 17/04, C07C  
323/58, 319/02, 319/14 // C07D 233/76

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/07108

(22) 国際出願日: 2003 年6 月5 日 (05.06.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2002-164598 2002 年6 月5 日 (05.06.2002) JP  
特願2002-237698 2002 年8 月16 日 (16.08.2002) JP  
特願2003-67299 2003 年3 月12 日 (12.03.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 鐘淵化学工業株式会社 (KANEKA CORPORATION) [JP/JP]; 〒530-8288 大阪府 大阪市 北区中之島 3 丁目 2 番 4 号 Osaka (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 大石 孝洋 (OHISHI, Takahiro) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP). 難波 弘憲 (NANBA, Hirokazu) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP). 菅原 昌信 (SUGAWARA, Masanobu) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP). 泉田 将司 (IZUMIDA, Masashi) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP). 本田 達也 (HONDA, Tatsuya) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP). 森

耕平 (MORI, Kohei) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP). 柳澤 恵広 (YANAGISAWA, Satohiro) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP). 長嶋 伸夫 (NAGASHIMA, Nobuo) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP). 井上 健二 (INOUE, Kenji) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP).

(74) 代理人: 安富 康男, 外 (YASUTOMI, Yasuo et al.); 〒532-0011 大阪府 大阪市 淀川区西中島 5 丁目 4 番 20 号 中央ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

— 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

[続葉有]

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING OPTICALLY ACTIVE  $\alpha$ -METHYLCYSTEINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 光学活性  $\alpha$ -メチルシステイン誘導体の製造方法

(57) Abstract: It is intended to provide a process for conveniently producing on an industrial scale an optically active  $\alpha$ -methylcysteine derivative or its salt in the form of an L- or D-compound, which is useful as an intermediate of a drug, etc., from a less expensive and easily available material. Namely, a process for producing an optically active  $\alpha$ -methylcysteine derivative or its salt in the form of an L- or D-compound which comprises D-selectively cyclizing a racemic N-carbamoyl- $\alpha$ -methylcysteine derivative or its salt with the use of hydantoinase to give a D-5-methyl-5-thiomethylhydantoin derivative or its salt and N-carbamoyl- $\alpha$ -methyl-L-cysteine derivative or its salt, and then deblocking and hydrolyzing the amino group and the sulfur atom of each product.

(57) 要約: 本発明は、医薬品等の中間体として有用な、L 体又は D 体の光学活性  $\alpha$ -メチルシステイン誘導体又はその塩を、安価で入手容易な原料から、簡便かつ工業的に製造する方法を提供する。本発明は、ラセミ体 N-カルバモイル- $\alpha$ -メチルシステイン誘導体又はその塩をヒダントイナーゼによって D 体選択的に環化させて、D-5-メチル-5-チオメチルヒダントイン誘導体又はその塩及び N-カルバモイル- $\alpha$ -メチル-L-システイン誘導体又はその塩とし、次いで、それぞれのアミノ基、硫黄原子の脱保護及び加水分解を行うことによる、L 体又は D 体の光学活性  $\alpha$ -メチルシステイン誘導体又はその塩の製造方法である。



WO 03/106689 A1



2文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。