

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
21 avril 2005 (21.04.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/035540 A3

(51) Classification internationale des brevets⁷ : C07F 5/02

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2004/002573

(22) Date de dépôt international :
11 octobre 2004 (11.10.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0311838 9 octobre 2003 (09.10.2003) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : PPG-SIPSY [FR/FR]; Z.I. La Croix-Cadeau, BP 79, F-49242 Avrillé Cedex (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : BURGOS, Alain [FR/FR]; 9, rue Paul Gauguin, F-49130 Les Ponts-De-Cé (FR). BERTRAND, Blandine [FR/FR]; Bas-clot, F-49440 Angrie (FR). FREIN, Stéphane [FR/FR]; La Chauvetterie, F-49190 Saint-Aubin-de-Luigné (FR). PLUVIE, Jean-François [FR/FR]; 55, rue de Villoutreys, F-49000 Angers (FR). ROUSSIASSE, Sonia [FR/FR]; La Rebinière, F-49125 Cheffes-Sur-Sarthe (FR).

(74) Mandataires : BRESSE, Pierre etc.; Bresse-Majerowicz, 3, avenue de l'Opéra, F-75001 Paris (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, 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, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 9 juin 2005

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) Title: METHOD FOR THE IN SITU PREPARATION OF CHIRAL COMPOUNDS DERIVED FROM OXAZABOROLIDINE-BORANE COMPLEXES, WHICH ARE USED IN ASYMMETRIC REDUCTION REACTIONS

(54) Titre : PROCEDE DE PREPARATION IN SITU DE COMPOSES CHIRAUX DERIVES DE COMPLEXES D'OXAZABOROLIDINE-BORANE UTILES DANS LES REACTIONS DE REDUCTION ASYMETRIQUE.

(57) Abstract: The invention relates to a method for the in situ preparation of chiral compounds derived from oxazaborolidine-borane complexes. According to the invention, a metal borohydride, a Lewis base and an inorganic acid ester are brought into contact with one another and, subsequently, an optically-active amino alcohol and, optionally, a halide are added. The compound thus produced is a complex that can be used as a catalyst in asymmetric reduction reactions. The reaction is continued with the addition of the material to be reduced, particularly prochiral etheroximes or ketones, for the synthesis of chiral alcohols or chiral amines.

(57) Abrégé : L'invention a pour objet un procédé de préparation in situ de composés chiraux dérivés de complexes d'oxazaborolidine-borane, dans lequel on met en présence un borohydrure de métal, une base de Lewis, un ester d'acide inorganique, puis on additionne un amino-alcool optiquement actif et éventuellement un halogénure. Le composé obtenu est un complexe utile comme catalyseur dans les réactions de réduction asymétrique. La réaction se poursuit par ajout de la matière à réduire, en particulier des cétones ou étheroximes prochirales, en vue de la synthèse d'alcools chiraux ou d'amines chirales.



WO 2005/035540 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/FR2004/002573

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07F5/02

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07F

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 94/26751 A (QUALLICH GEORGE J ; PFIZER (US)) 24 November 1994 (1994-11-24) page 10, line 3 - line 7; claim 10 -----	1-22
A	US 5 264 574 A (CARROLL JAMES D ET AL) 23 November 1993 (1993-11-23) claim 1 -----	1-22
A	US 5 189 177 A (BLACKLOCK THOMAS J ET AL) 23 February 1993 (1993-02-23) column 6, line 1 - line 32 -----	1-22

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- * & * document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

24 March 2005

Date of mailing of the international search report

11/04/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Seelmann, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/FR2004/002573

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9426751	A	24-11-1994	AT 149171 T	15-03-1997
			AU 674067 B2	05-12-1996
			AU 6289694 A	12-12-1994
			CA 2161969 A1	24-11-1994
			CN 1124962 A ,C	19-06-1996
			DE 69401813 D1	03-04-1997
			DE 69401813 T2	05-06-1997
			DK 698028 T3	25-08-1997
			EP 0698028 A1	28-02-1996
			ES 2098928 T3	01-05-1997
			FI 942240 A	15-11-1994
			GR 3022924 T3	30-06-1997
			WO 9426751 A1	24-11-1994
			IL 109563 A	29-02-2000
			IL 132627 A	06-12-2000
			JP 2706851 B2	28-01-1998
			JP 8506345 T	09-07-1996
			KR 180262 B1	15-05-1999
			NO 954566 A	13-11-1995
			NZ 262945 A	27-08-1996
			TW 416958 B	01-01-2001
			US 6037505 A	14-03-2000
			US 6005133 A	21-12-1999
			ZA 9403295 A	13-11-1995
US 5264574	A	23-11-1993	GB 2265620 A	06-10-1993
US 5189177	A	23-02-1993	US 5039802 A	13-08-1991
			US 5264585 A	23-11-1993
			CA 2040606 A1	19-10-1991
			DE 69115105 D1	18-01-1996
			DE 69115105 T2	25-07-1996
			DE 69131967 D1	09-03-2000
			DE 69131967 T2	17-08-2000
			EP 0453298 A2	23-10-1991
			EP 0668266 A1	23-08-1995
			EP 0962451 A2	08-12-1999
			JP 3262810 B2	04-03-2002
			JP 4224556 A	13-08-1992
			JP 2002193929 A	10-07-2002

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No

PCT/FR2004/002573

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE

CIB 7 C07F5/02

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)

CIB 7 C07F

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie °	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	WO 94/26751 A (QUALLICH GEORGE J ; PFIZER (US)) 24 novembre 1994 (1994-11-24) page 10, ligne 3 - ligne 7; revendication 10	1-22
A	US 5 264 574 A (CARROLL JAMES D ET AL) 23 novembre 1993 (1993-11-23) revendication 1	1-22
A	US 5 189 177 A (BLACKLOCK THOMAS J ET AL) 23 février 1993 (1993-02-23) colonne 6, ligne 1 - ligne 32	1-22



Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents



Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe

° Catégories spéciales de documents cités:

- *A* document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent
- *E* document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date
- *L* document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)
- *O* document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens
- *P* document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée

T document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention

X document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément

Y document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier

Z document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

24 mars 2005

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

11/04/2005

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale

Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Seelmann, I

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Renseignements relatifs aux membres de familles de brevets

Demande internationale No

PCT/FR2004/002573

Document brevet cité au rapport de recherche	Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO 9426751 A	24-11-1994	AT 149171 T	15-03-1997
		AU 674067 B2	05-12-1996
		AU 6289694 A	12-12-1994
		CA 2161969 A1	24-11-1994
		CN 1124962 A ,C	19-06-1996
		DE 69401813 D1	03-04-1997
		DE 69401813 T2	05-06-1997
		DK 698028 T3	25-08-1997
		EP 0698028 A1	28-02-1996
		ES 2098928 T3	01-05-1997
		FI 942240 A	15-11-1994
		GR 3022924 T3	30-06-1997
		WO 9426751 A1	24-11-1994
		IL 109563 A	29-02-2000
		IL 132627 A	06-12-2000
		JP 2706851 B2	28-01-1998
		JP 8506345 T	09-07-1996
		KR 180262 B1	15-05-1999
		NO 954566 A	13-11-1995
		NZ 262945 A	27-08-1996
		TW 416958 B	01-01-2001
		US 6037505 A	14-03-2000
		US 6005133 A	21-12-1999
		ZA 9403295 A	13-11-1995
US 5264574 A	23-11-1993	GB 2265620 A	06-10-1993
US 5189177 A	23-02-1993	US 5039802 A	13-08-1991
		US 5264585 A	23-11-1993
		CA 2040606 A1	19-10-1991
		DE 69115105 D1	18-01-1996
		DE 69115105 T2	25-07-1996
		DE 69131967 D1	09-03-2000
		DE 69131967 T2	17-08-2000
		EP 0453298 A2	23-10-1991
		EP 0668266 A1	23-08-1995
		EP 0962451 A2	08-12-1999
		JP 3262810 B2	04-03-2002
		JP 4224556 A	13-08-1992
		JP 2002193929 A	10-07-2002