(19)日本国特許庁（ＪＰ）　(12) **公開特許公報**（Ａ）　(11)特許出願公開番号
特開2003－261589
（P2003－261589A）
(43)公開日　平成15年９月19日(2003.9.19)

(51)Int.Cl.[7]	識別記号	ＦＩ	ﾃｰﾏｺｰﾄﾞ(参考)
Ｃ０７Ｈ　3/06		Ｃ０７Ｈ　3/06	４Ｃ０５７
15/18		15/18	

審査請求　未請求　請求項の数４　ＯＬ　（全 3 頁）

(21)出願番号　特願2002－61415(P2002－61415)

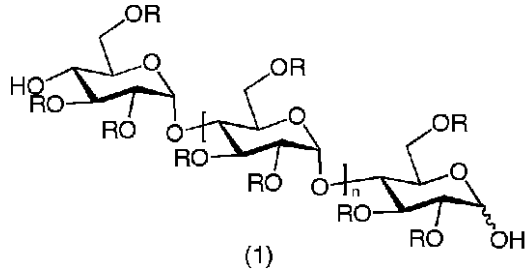
(22)出願日　平成14年３月７日(2002.3.7)

(71)出願人　000173924
財団法人野口研究所
東京都板橋区加賀１－８－１
(72)発明者　山ノ井　孝
神奈川県横浜市磯子区栗木１丁目26番14号
(72)発明者　室田　明彦
東京都練馬区東大泉２丁目35番14号

Ｆターム(参考)　4C057 AA18 BB04 DD02 JJ20

(54)【発明の名称】　マルトオリゴ糖誘導体とその製造法

(57)【要約】
【課題】医薬や農薬の中間体として有用なマルトオリゴ糖誘導体とそのマルトオリゴ糖誘導体を効率良く製造する方法を提供することである。
【解決手段】式（1）で示されるマルトオリゴ糖誘導体。
【化１】



(1)

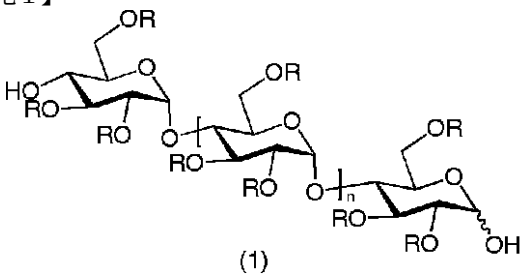
（式中、ｎは０～３、5～6の整数を、Ｒはアルキル基またはアラルキル基を示す。）である。また、水酸基をアルキル基またはアラルキル基で保護したパーアルキルシクロデキストリンあるいはパーアラルキルシクロデキストリンを高圧下で特定の反応温度範囲を用いることで、グリコシド結合の加水分解が途中段階にあり、切断されたグリコシド結合以外の水酸基にはアルキル基またはアラルキル基を持つマルトオリゴ糖誘導体の製造法である。

1

【特許請求の範囲】

【請求項１】一般式（１）であらわされるマルトオリゴ糖誘導体。

【化１】

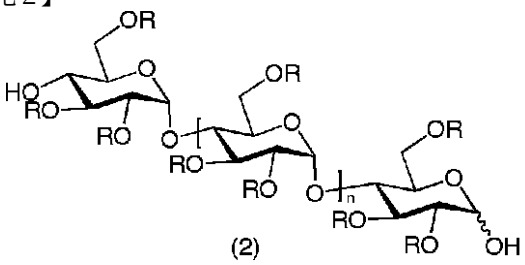


(1)

（式中、ｎは０～３、5～6の整数を、Ｒはアルキル基またはアラルキル基を示す。）

【請求項２】水酸基をアルキル基またはアラルキル基で保護したパーアルキルシクロデキストリンまたはパーアラルキルシクロデキストリンを高温高圧下で加水分解反応させることを特徴とする一般式（２）であらわされるマルトオリゴ糖誘導体の製造法。

【化２】



(2)

（式中、ｎは０～6の整数を、Ｒはアルキル基またはアラルキル基を示す。）

【請求項３】パーアラルキルシクロデキストリンとしてパーベンジルシクロデキストリンを用いることを特徴とする請求項２記載の製造法。

【請求項４】パーアルキルシクロデキストリンまたはパーアラルキルシクロデキストリンの加水分解温度として、２２０～２６０℃範囲を用いることを特徴とする請求項２記載の製造法。

【発明の詳細な説明】

【０００１】

【発明の属する技術分野】マルトオリゴ糖誘導体は医薬や農薬の中間体として有用で、水酸基がアルキル基やアラルキル基で保護されたマルトオリゴ糖誘導体は、これらを製造する上で重要な化合物である。本発明は、マルトオリゴ糖誘導体とそのマルトオリゴ糖誘導体の製造法に関するものである。

【０００２】

【従来の技術】従来これまでに、パーベンジルシクロデキストリンの加水分解反応として、ジオキサン中、酸触媒として濃硫酸を用いた方法や高温高圧下の熱水を用いた方法が報告されている（T.Sato等、Carbohydr.Res.、199巻、 31-35頁、1990年）。しかしこれらの方法では

2

パーベンジルシクロデキストリンのすべてのグリコシド結合が加水分解され、単糖のグルコース誘導体の生成のみが報告されている。部分加水分解生成物であるマルトオリゴ糖誘導体の生成は反応条件を詳細に吟味する必要があり、これまでその製造法は知られていない。

【０００３】

【発明が解決しようとする課題】本発明が解決しようとする課題は、マルトオリゴ糖誘導体とそのマルトオリゴ糖誘導体の効率的な製造法を目指し、工業的なスケールでの製造法を提供することである。

【０００４】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、すべての水酸基をアルキル基あるいはアラルキル基で保護したパーアルキルシクロデキストリンまたはパーアラルキルシクロデキストリンを、高圧下、特定の反応温度範囲を用いることで、グリコシド結合の加水分解が途中段階にあり、切断されたグリコシド結合以外の水酸基にはアルキル基またはアラルキル基を持つマルトオリゴ糖誘導体が製造できることを知り、本発明に到達した。すなわち、本発明は水酸基をアルキル基あるいはアラルキル基で保護したパーアルキルシクロデキストリンあるいはパーアラルキルシクロデキストリンを高温高圧下で加水分解反応させて一般式（1）で表されるマルトオリゴ糖誘導体と一般式（2）であらわされるマルトオリゴ糖誘導体の製造法である。

【０００５】

【発明の実施の形態】以下、本発明を詳細に説明する。

【０００６】本発明で使用する原料であるシクロデキストリンは、周知のシクロデキストリンから誘導されたものを使用することができる。例えば、α－シクロデキストリン、β－シクロデキストリンおよびγ－シクロデキストリンを挙げることができる。その水酸基の保護基には、周知のアルキル基あるいはアラルキル基を使用することができる。例えば、メチル基、ベンジル基、アリル基、パラクロロベンジル基等を挙げることができるが、好ましくはベンジル基である。

【０００７】パーアルキルシクロデキストリンあるいはパーアラルキルシクロデキストリンの加水分解は、高圧下の熱水を用いてを行う。溶媒として水のみを用いて加水分解することもできるが、水と有機溶媒との混合溶媒中で行うことが好ましい。有機溶媒としては、水との親和性の高いものが良く、例えばジメチルホルムアミドやジオキサンを使用することができる。水と有機溶媒との混合体積比は１０対１から１対１０の範囲で使用することができるが、好ましくは３対１から１対３の範囲で使用する。

【０００８】反応温度は220℃から260℃の間で行うが、好ましくは２３０℃から２５０℃の範囲で行う。圧力は、溶媒の温度が上記の温度になることが可能な圧力範囲であれば何ら問題はなく、通常１００から３００気

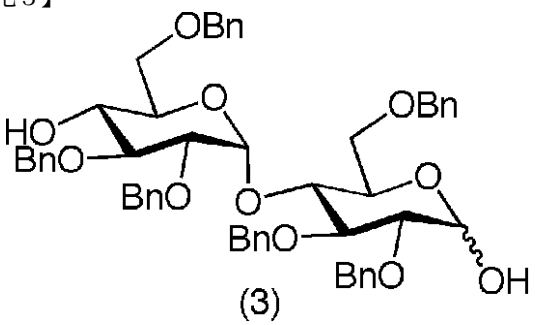
圧の範囲で行う。反応時間は、原料の種類、反応温度によって異なるが、通常数分から数十時間の範囲である。

【０００９】以下に実施例を挙げて本発明を具体的に説明するが、以下の実施例により何等の制限を受けるものではない。

【００１０】

【実施例１】パーベンジルシクロデキストリン100mgをジオキサン-水（混合体積比v/v=1/1）５ mlに溶解し、送液ポンプでジオキサン-水の混合溶媒（混合体積比v/v=1/1）を用いて、１５０atm下の直径１mmのステンレス管に送り込む。２４０℃で４０分間放置後、ジオキサンでステンレス管を洗い、溶媒を留去して反応混合濃縮物を得る。濃縮物のESI－ハイマススペクトルを測定したところ、（3）、（4）、（5）、（6）、（7）で示される化合物が確認された。これらを、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）で単離する。

【化３】

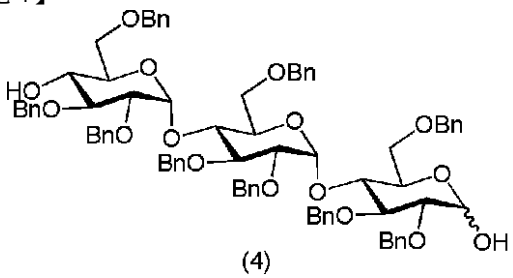


(3)

（式中、Ｂｎはベンジル基を示す。）

$C_{54}H_{58}O_{11}Na$; Calcd. Mas 905.3877; Found: m/z 905.3573.

【化４】

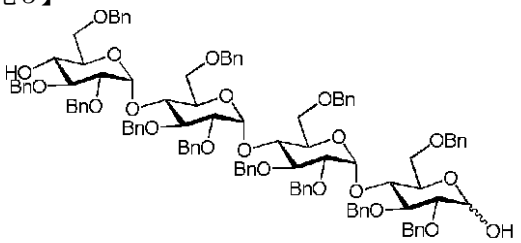


(4)

（式中、Ｂｎはベンジル基を示す。）

$C_{81}H_{86}O_{16}Na$; Calcd. Mas 1337.5814; Found: m/z 1337.5330.

【化５】

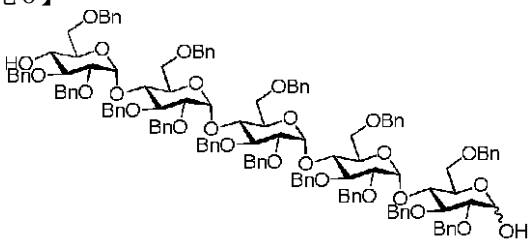


(5)

（式中、Ｂｎはベンジル基を示す。）

$C_{108}H_{114}O_{21}Na$; Calcd. Mas 1769.7750; Found: m/z 1769.7244.

【化６】

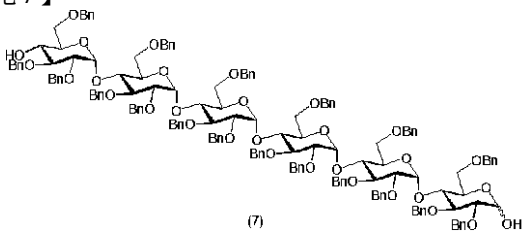


(6)

（式中、Ｂｎはベンジル基を示す。）

$C_{135}H_{142}O_{26}Na$; Calcd. Mas 2201.9687; Found: m/z 2201.8674.

【化７】



(7)

（式中、Ｂｎはベンジル基を示す。）

$C_{162}H_{170}O_{31}Na$; Calcd. Mas 2201.9687; Found: m/z 2201.8674.

【発明の効果】本発明は、医薬や農薬の中間体として有用なマルトオリゴ糖誘導体とそのマルトオリゴ糖誘導体を効率的に製造する方法を提供することができる。