

(19) 日本国特許庁(JP)

## (12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2018-529703

(P2018-529703A)

(43) 公表日 平成30年10月11日(2018.10.11)

(51) Int.Cl.

C07D 271/113 (2006.01)

F 1

C07D 271/113

テーマコード(参考)

4 C 0 5 6

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 16 頁)

(21) 出願番号 特願2018-515819 (P2018-515819)  
 (86) (22) 出願日 平成28年9月23日 (2016.9.23)  
 (85) 翻訳文提出日 平成30年5月18日 (2018.5.18)  
 (86) 國際出願番号 PCT/EP2016/072629  
 (87) 國際公開番号 WO2017/055175  
 (87) 國際公開日 平成29年4月6日 (2017.4.6)  
 (31) 優先権主張番号 15187023.5  
 (32) 優先日 平成27年9月28日 (2015.9.28)  
 (33) 優先権主張國 歐州特許庁 (EP)

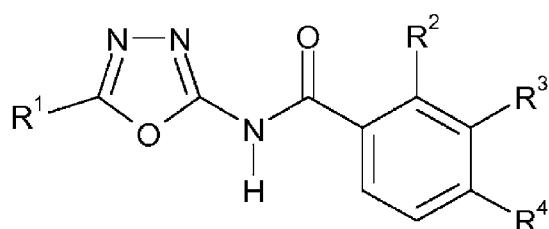
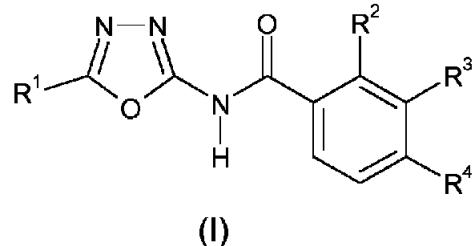
(71) 出願人 507203353  
 バイエル・クロップサイエンス・アクチエ  
 ンゲゼルシャフト  
 ドイツ国、40789・モンハイム・アム  
 ・ライン、アルフレートーノベルーシュト  
 ラーゼ・50  
 (74) 代理人 100114188  
 弁理士 小野 誠  
 (74) 代理人 100119253  
 弁理士 金山 賢教  
 (74) 代理人 100124855  
 弁理士 坪倉 道明  
 (74) 代理人 100129713  
 弁理士 重森 一輝

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 N-(1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル) アリールカルボキサミド類を合成する方法

## (57) 【要約】

式(I)で表されるN-(1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)アリールカルボキサミドを合成する方法が記載されており、ここで、該置換基は、水素、アルキル、ハロアルキル又はアリールなどの基を表す。

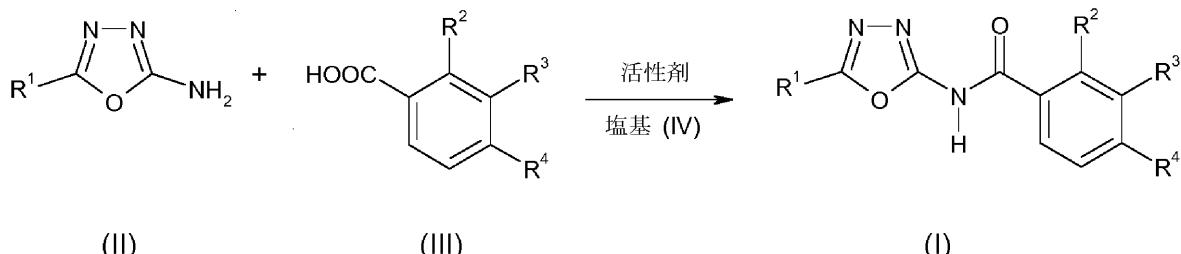


## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式(II)で表される2-アミノ-1,3,4-オキサジアゾールを式(III)で表される安息香酸と反応させることによって式(I)で表されるN-(1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)アリールカルボキサミドを調製する方法であって、

## 【化1】

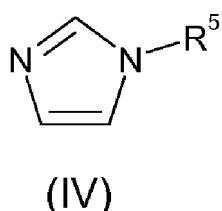


ここで、該方法は、  
(a) 塩化チオニル、ホスゲン、ジホスゲン、塩化メシリル、塩化トシリル、POCl<sub>3</sub>、PCl<sub>5</sub>、塩化オキサリル及びC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキル-OOC(O)Clからなる群から選択される活性化試薬の存在下で；及び、

(b) 一般式(IV)

## 【化2】

20



で表される塩基の存在下で；

30

実施すること；並びに、

(c) ここで、置換基は、下記：

R<sup>1</sup>は、水素、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はフェニルであり；

R<sup>2</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-アルキル又はハロゲンであり；

R<sup>3</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルスルフェニル、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルスルフィニル又はC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキルスルホニルであり；

R<sup>4</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-アルキル又はC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-ハロアルキルであり；

R<sup>5</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-アルキル又はフェニルである；

のように定義されることを特徴とする、前記方法。

40

## 【請求項 2】

式(II)で表される化合物を式(III)で表される化合物に対して10%過剰に使用する、請求項1に記載の方法。

## 【請求項 3】

活性化剤として塩化チオニル、ホスゲン又はジホスゲンを使用する、請求項1又は2に記載の方法。

## 【請求項 4】

活性化剤として塩化チオニルを使用する、請求項1～3のいずれかに記載の方法。

## 【請求項 5】

前記活性化剤と式(III)で表される化合物を1.2～1.9のモル比で使用する、

50

請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の方法。

**【請求項 6】**

式(IV)で表される塩基と式(III)で表される化合物を1~2.5のモル比で使用する、請求項1~5のいずれかに記載の方法。

**【請求項 7】**

使用する溶媒がテトラヒドロフラン、アセトニトリル、2-メチル-5-エチルピリジン又は3-メチルピリジンである、請求項1~6のいずれかに記載の方法。

**【請求項 8】**

使用する溶媒が3-メチルピリジンである、請求項1~8のいずれかに記載の方法。

**【請求項 9】**

10

R<sup>1</sup>は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル又はフェニルであり；

R<sup>2</sup>は、メチル又は塩素であり；

R<sup>3</sup>は、メチルスルフェニル、メチルスルフィニル又はメチルスルホニルであり；

R<sup>4</sup>は、トリフルオロメチルであり；

R<sup>5</sup>は、メチル又はn-ブチルである；

請求項1~8のいずれかに記載の方法。

**【請求項 10】**

20

R<sup>1</sup>は、メチルであり；

R<sup>2</sup>は、メチル又は塩素であり；

R<sup>3</sup>は、メチルスルホニルであり；

R<sup>4</sup>は、トリフルオロメチルであり；

R<sup>5</sup>は、メチルである；

請求項1~9のいずれかに記載の方法。

**【請求項 11】**

前記反応を0~25の範囲内で実施する、請求項1~10のいずれかに記載の方法。

【発明の詳細な説明】

**【技術分野】**

**【0001】**

本発明は、除草活性を有するN-(1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)アリールカルボキサミド類を調製する方法に関する。

30

**【背景技術】**

**【0002】**

WO 2012/126932A1には、除草活性を有するN-(1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)アリールカルボキサミド類が開示されている。その中には、それらを調製する方法も記載されている。その方法では、置換されている安息香酸を、カルボニルイミダゾール(CDI)、ジシクロヘキシリカルボジイミド又は2,4,6-トリプロピル-1,3,5,2,4,6-トリオキサトリホスホリナン-2,4,6-トリオキシドなどの活性化試薬の存在下で、2-アミノ-1,3,4-オキサジアゾール類(これは、5位において置換されている)と反応させる。しかしながら、そのような試薬は、極めて高価であり且つ再使用できないので、大規模での反応には適していない。置換されている塩化ベンゾイルを2-アミノ-1,3,4-オキサジアゾールと反応させると、所望の2-ベンゾイルアミノ-1,3,4-オキサジアゾール類が生成されるのみではなく、異性体の3-ベンゾイル-2-イミノ-1,3,4-オキサジアゾリン類も生成されることは、「Zhur.Org.Khim.V.25,N.10,1989,2216」から知られている。

40

**【先行技術文献】**

**【特許文献】**

**【0003】**

**【特許文献1】国際特許出願公開第2012/126932A1号**

50

【非特許文献】

〔 0 0 0 4 〕

【非特許文献 1】Zhur. Org. Khim., V. 25, N. 10, 1989,  
2216

## 【発明の概要】

#### 【発明が解決しようとする課題】

〔 0 0 0 5 〕

本発明の目的は、従来技術から知られている方法の不利点を克服する、N-(1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)アリールカルボキサミド類を調製する方法を提供することである。

#### 【課題を解決するための手段】

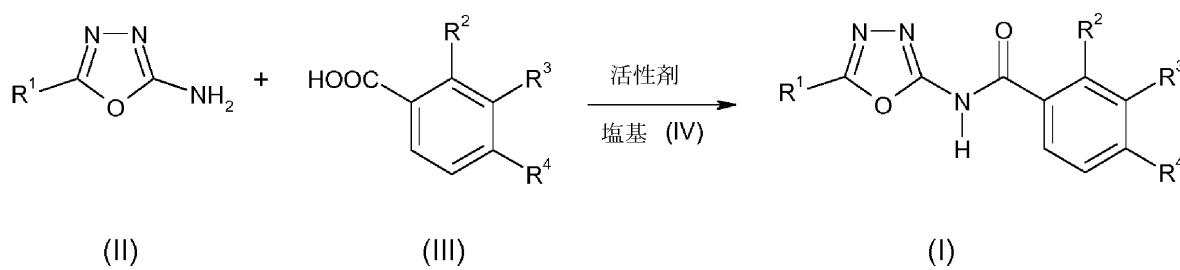
[ 0 0 0 6 ]

置換されている安息香酸を安価な活性化試薬と塩基の存在下で5位において置換されている2-アミノ-1,3,4-オキサジアゾールと反応させることによって、N-(1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)アリールカルボキサミドを費用効果的に高い收率で調製し得るということが分かった。

[ 0 0 0 7 ]

従つて、本発明は、一般式(II)で表される2-アミノ-1,3,4-オキサジアゾールを一般式(III)で表される安息香酸と反応させることによって一般式(I)で表されるN-(1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)アリールカルボキサミドを調製する方法に關し、

【化 1】



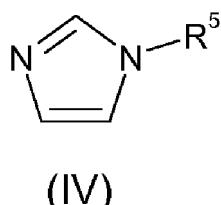
【 0 0 0 8 】

ここで、該方法は、

(a) 塩化チオニル、ホスゲン、ジホスゲン、塩化メシリ、塩化トシリ、 $\text{POCl}_3$ 、 $\text{PCl}_5$ 、塩化オキサリル及び $\text{C}_1 - \text{C}_8$ -アルキル- $\text{OC(O)Cl}$ からなる群から選択される活性化試薬(活性化剤)の存在下で; 及び、

( b ) 一般式 ( I V )

【化 2】



【 0 0 0 9 】

で表される塩基の存在下で；  
実施すること；並びに、

(c) ここで、置換基は、下記：

R<sup>1</sup>は、水素、C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub> - アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はフェニルであり；

R<sup>2</sup>は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub> - アルキル又はハロゲンであり；

R<sup>3</sup>は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルスルフェニル、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルスルフィニル又はC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> - アルキルスルホニルであり；

R<sup>4</sup>は、C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub> - アルキル又はC<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - ハロアルキルであり；

R<sup>5</sup>は、C<sub>1</sub> - C<sub>12</sub> - アルキル又はフェニルである；

のように定義されることを特徴とする。

#### 【0010】

本発明による方法の主要な有利点は、収率が高いこと、安価な試薬を使用すること、及び、式(I V)で表される塩基を再使用できることである。

#### 【発明を実施するための形態】

#### 【0011】

式(I II I)で表される置換されている安息香酸は、例えばWO 2012 / 126932A1から、知られている。式(I I)で表される2-アミノ-1,3,4-オキサジアゾールは、市販されているか、又は、カルボン酸ヒドラジドから、例えば、「Tetrahedron, 69, 2013 2075 - 2080」に記載されている方法によって、調製することができる。式(I V)で表される塩基も、同様に、市販されているか、又は、当業者には知られている方法で得ることができる。

#### 【0012】

式(I)、式(I I)、式(I II I)及び式(I V)において、3個以上の炭素原子を有するアルキルラジカルは、直鎖又は分枝鎖であることができる。アルキルラジカルは、例えば、メチル、エチル、n-プロピル又はイソプロピル、n-ブチル、イソブチル、t-ブチル又は2-ブチル、ペンチル類、ヘキシル類、例えば、n-ヘキシル、イソヘキシル及び1,3-ジメチルブチルである。同様のことは、アルコキシラジカル及びシクロアルキルラジカルにも当てはまる。

#### 【0013】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、好ましくは、フッ素又は塩素である。

#### 【0014】

ある基が複数のラジカルで多置換されている場合、これは、該基が記載されているラジカルから選択される1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換されていることを意味するものと理解されるべきである。

#### 【0015】

式(I I)で表される化合物と式(I II I)で表される化合物は、典型的には、0.8 ~ 1.5のモル比で使用する。式(I I)で表される化合物は、好ましくは、式(I II I)で表される化合物に対して10%過剰に使用する。

#### 【0016】

該活性化剤と式(I II I)で表される化合物は、典型的には、0.5 ~ 3のモル比で、好ましくは、1 ~ 2のモル比で、特に好ましくは、1.2 ~ 1.9のモル比で、使用する。

#### 【0017】

使用する活性化剤は、好ましくは、塩化チオニル、ホスゲン又はジホスゲンであり、特に好ましくは、塩化チオニルである。

#### 【0018】

式(I V)で表される塩基と式(I II I)で表される化合物は、典型的には、0.5 ~ 1.0のモル比で、好ましくは、1 ~ 3のモル比で、特に好ましくは、1 ~ 2.5のモル比で、使用する。

#### 【0019】

10

20

30

40

50

本発明による方法は、一般に、溶媒の中で実施する。適切な溶媒は、不活性有機溶媒であり、好ましくは、脂肪族、脂環式又は芳香族の炭化水素類、例えば、石油エーテル、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、メチルシクロヘキサン、ベンゼン、トルエン、キレン及びデカリン；ハロゲン化炭化水素類、例えば、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン及びトリクロロエタン；エステル類、例えば、酢酸エチル及び酢酸イソプロピル；エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテル、メチルtert-アミルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、1,2-ジエトキシエタン及びアニソール；ケトン類、例えば、アセトン、ブタノン、メチルイソブチルケトン及びシクロヘキサン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、n-ブチロニトリル、i-ブチロニトリル及びベンゾニトリル；アミド類、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチルホルムアミド、N-メチルピロリドン及びヘキサメチルホスホルアミド；ピリジン類、例えば、2-メチルピリジン、3-メチルピリジン、4-メチルピリジン、2,3-ジメチルピリジン、2-メチル-5-エチルピリジン、2,6-ジメチルピリジン、2,4-ジメチルピリジン、3,4-ジメチルピリジン及び2,4,6-トリメチルピリジンである。上記溶媒の混合物も適している。

10

## 【0020】

本発明による方法において使用する溶媒は、好ましくは、テトラヒドロフラン、アセトニトリル、3-メチルピリジン又は2-メチル-5-エチルピリジンである。特に好ましいのは、3-メチルピリジンである。

20

## 【0021】

本発明による方法は、典型的には、-5 ~ 50 の温度範囲内で、好ましくは、0 ~ 25 の温度範囲内で、実施する。

## 【0022】

本発明による方法は、典型的には、式(I)、式(II)及び式(IV)で表される化合物を溶媒の中に装入し、そして、攪拌しながら活性化剤をゆっくりと滴下して加えるようにして、又は、ホスゲンの場合には、添加するようにして、実施する。その反応の進行は、HPLCでモニターすることができる。該反応は、一般に、10 ~ 20時間後に完了する。

30

## 【0023】

該反応が終了した後、その反応混合物を冷却し、そして、生成物は一般に実質的に定量的に沈澱する。あるいは、該反応混合物を極性溶媒（例えば、水、又は、アルコール類、例えば、イソプロパノール）で希釈することができる。式(I)で表される反応生成物が高純度で得られ、そして、必要に応じて、さらに精製することができる。該反応混合物に、20 ~ 35 の温度で、3 ~ 6時間かけて水を添加することが特に有利である。この場合、該生成物は、容易に濾過することが可能な形態で得られる。母液を水酸化ナトリウム水溶液で処理した後、式(IV)で表される塩基の約95%を蒸留によって回収することができる。

40

## 【0024】

本発明による方法は、好ましくは、式(I)及び(II)〔式中、  
 R<sup>1</sup>は、水素、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル又はフェニルであり；  
 R<sup>2</sup>は、メチル又は塩素であり；  
 R<sup>3</sup>は、メチルスルフェニル、メチルスルフィニル又はメチルスルホニルであり；  
 R<sup>4</sup>は、トリフルオロメチルであり；  
 R<sup>5</sup>は、メチル又はn-ブチルである〕

で表される化合物を用いて実施する。

## 【0025】

本発明による方法は、特に好ましくは、式(I)及び(II)〔式中、  
 R<sup>1</sup>は、メチルであり；

50

R<sup>2</sup>は、メチル又は塩素であり；  
R<sup>3</sup>は、メチルスルホニルであり；  
R<sup>4</sup>は、トリフルオロメチルであり；  
R<sup>5</sup>は、メチルである】

で表される化合物を用いて実施する。

#### 【0026】

下記調製実施例によって、本発明についてさらに詳細に説明する。

#### 【実施例】

#### 【0027】

2 - メチル - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 3 - ( メチルスルホニル ) - 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミドの調製 ( 变形態様 1 )

57 g ( 200 mmol ) の 2 - メチル - 3 - メチルスルホニル - 4 - トリフルオロメチル安息香酸、21.8 g ( 220 mmol ) の 2 - アミノ - 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール及び 32.8 g ( 400 mmol ) の N - メチルイミダゾールを 300 mL の 3 - メチルピリジンに溶解させ、30 分間攪拌した。10 分まで冷却した後、38.2 g ( 320 mmol ) の 塩化チオニルを、反応混合物の温度が 10 と 20 の間で維持されるように、60 分間かけて滴下して加えた。次いで、その反応混合物を 20 でさらに 18 時間攪拌した。次いで、200 mL の水を、反応混合物の温度が 25 と 30 の間で維持されるように、30 分間かけて滴下して加えた。その反応混合物を 40 ~ 45 で 4 時間攪拌し、20 分まで冷却した。濾過後、その生成物を 200 mL の水及び 100 mL の 5 % 塩酸で洗浄した。その残渣を乾燥させた後、62.4 g の 2 - メチル - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 3 - ( メチルスルホニル ) - 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミドが得られた ( 収率 86 % )。

#### 【0028】

2 - メチル - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 3 - ( メチルスルホニル ) - 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミドの調製 ( 变形態様 2 )

57 g ( 200 mmol ) の 2 - メチル - 3 - メチルスルホニル - 4 - トリフルオロメチル安息香酸、21.8 g ( 220 mmol ) の 2 - アミノ - 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール及び 32.8 g ( 400 mmol ) の N - メチルイミダゾールを 300 mL の 3 - メチルピリジンに溶解させ、30 分間攪拌した。10 分まで冷却した後、38.2 g ( 320 mmol ) の 塩化チオニルを、反応混合物の温度が 10 と 20 の間で維持されるように、60 分間かけて滴下して加えた。次いで、その反応混合物を 20 でさらに 18 時間攪拌した。次いで、200 mL の水を、反応混合物の温度が 25 と 30 の間で維持されるように、6 時間かけて滴下して加えた。得られた懸濁液を 15 分まで冷却し、濾過し、その濾過ケーキを 200 mL の水及び 100 mL の 5 % 塩酸で洗浄した。その残渣を乾燥させた後、65.5 g の 2 - メチル - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 3 - ( メチルスルホニル ) - 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミドが得られた ( 収率 90 % )。

#### 【0029】

比較することを目的として、上記反応を、WO 2012 / 126932 A1 から知られている試薬である塩化オキサリル ( 塩化チオニルの代わり ) 及び 4 - ジメチルアミノピリジン ( N - メチルイミダゾールの代わり ) を使用し、それ以外は同じ条件下で化学量論的な比率で実施した。これによって、11.1 g の 2 - メチル - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) - 3 - ( メチルスルホニル ) - 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミドが得られた ( 収率 15 % )。

10

20

30

40

## 【国際調査報告】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/EP2016/072629

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
INV. C07D271/113  
ADD.

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)  
C07D

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 practicable, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; AHRENS HARTMUT [DE]; BRAU) 27 September 2012 (2012-09-27) cited in the application Seite 9, Zeilen 15-22. Seite 28, Beispiel 2.; page 9 ----- X WO 2013/064459 A1 (BAYER IP GMBH [DE]) 10 May 2013 (2013-05-10) Seite 20, Zeilen 1-6. Seite 37, Beispiel 1 ----- A WO 2013/124228 A1 (BAYER IP GMBH [DE]) 29 August 2013 (2013-08-29) Seite 44, Schritt 2. ----- -/-	1-11  1-11  1-11

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family 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 application or patent 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

Date of mailing of the international search report

7 November 2016

16/11/2016

Name and mailing address of the ISA/

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

Authorized officer

Von Daacke, Axel

1

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2016/072629
---

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2012/130780 A1 (HOFFMANN LA ROCHE [CH]; HERMANN JOHANNES CORNELIUS [US]; LOWRIE JR LEE) 4 October 2012 (2012-10-04) example 37 -----	1
A	WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; BRAUN RALF [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; VAN ALMS) 8 March 2012 (2012-03-08) Seite 32, Schritt 5. -----	1
A	GOSWAMI S ET AL: "Molecular Recognition: Hydrogen bonding induced configurational locking of a new Photoresponsive receptor by Dicarboxylic acids", TETRAHEDRON LETTERS, PERGAMON, GB, vol. 40, no. 9, 26 February 1999 (1999-02-26), pages 1735-1738, XP004157179, ISSN: 0040-4039, DOI: 10.1016/S0040-4039(98)02678-1 Schema 1. -----	1
A	ALIASGHAR JARRAHPOUR ET AL: "Synthesis of some new monocyclic [beta]-lactams as antimalarial agents", IRANIAN CHEMICAL SOCIETY. JOURNAL, vol. 12, no. 12, 27 June 2015 (2015-06-27), pages 2083-2092, XP055235675, IR ISSN: 1735-207X, DOI: 10.1007/s13738-015-0685-x Schema 3, Reaktion von 4d nach 5d. -----	1
A	WO 2008/004117 A1 (PFIZER PROD INC [US]; HOOVER DENNIS JAY [US]; WITTER KEVIN G [US]) 10 January 2008 (2008-01-10) Seite 94, Preparation 11A. -----	1
A	WO 02/26731 A2 (COR THERAPEUTICS INC [US]; ZHU BING YAN [US]; HUANG WENRONG [US]; ZHAN) 4 April 2002 (2002-04-04) example 4 -----	1
A	WO 2014/114779 A1 (LUNDBECK & CO AS H [DK]) 31 July 2014 (2014-07-31) Seite 28, Schema 4. Seite 45, Y44. -----	1

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2016/072629

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012126932 A1	27-09-2012	AR 085469 A1 AU 2012230388 A1 BR 112013023911 A2 CA 2830773 A1 CN 103596946 A DK 2688885 T3 EA 201391320 A1 EP 2688885 A1 JP 2014510088 A KR 20140027953 A SI 2688885 T1 US 2014080705 A1 WO 2012126932 A1 ZA 201307815 B	02-10-2013 03-10-2013 09-08-2016 27-09-2012 19-02-2014 12-09-2016 28-02-2014 29-01-2014 24-04-2014 07-03-2014 28-10-2016 20-03-2014 27-09-2012 29-04-2015
WO 2013064459 A1	10-05-2013	AR 088615 A1 AU 2012331283 A1 CA 2854060 A1 CN 104024235 A EP 2773626 A1 HK 1201272 A1 JP 5982004 B2 JP 2014532679 A KR 20140091034 A RU 2014122431 A US 2014309112 A1 WO 2013064459 A1	25-06-2014 22-05-2014 10-05-2013 03-09-2014 10-09-2014 28-08-2015 31-08-2016 08-12-2014 18-07-2014 10-12-2015 16-10-2014 10-05-2013
WO 2013124228 A1	29-08-2013	AR 090091 A1 CN 104125949 A EP 2817296 A1 JP 2015508766 A US 2015018209 A1 WO 2013124228 A1	15-10-2014 29-10-2014 31-12-2014 23-03-2015 15-01-2015 29-08-2013
WO 2012130780 A1	04-10-2012	CA 2828824 A1 EP 2691399 A1 ES 2588680 T3 JP 6001048 B2 JP 2014512347 A KR 20140020972 A RU 2013145299 A US 2012252777 A1 WO 2012130780 A1	04-10-2012 05-02-2014 04-11-2016 05-10-2016 22-05-2014 19-02-2014 10-05-2015 04-10-2012 04-10-2012
WO 2012028579 A1	08-03-2012	AR 082828 A1 AU 2011298424 A1 BR 112013005070 A2 CA 2809487 A1 CN 103282354 A CO 6670599 A2 DK 2611785 T3 EA 201390265 A1 EP 2611785 A1 ES 2503815 T3 HR P20140779 T1 IL 224757 A JP 5805767 B2	09-01-2013 21-03-2013 26-04-2016 08-03-2012 04-09-2013 15-05-2013 25-08-2014 30-08-2013 10-07-2013 07-10-2014 07-11-2014 30-06-2015 10-11-2015

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2016/072629

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		JP 2013536817 A	26-09-2013
		KR 20130101506 A	13-09-2013
		PT 2611785 E	09-09-2014
		TW 201221059 A	01-06-2012
		UA 109150 C2	27-07-2015
		US 2012058892 A1	08-03-2012
		UY 33583 A	30-03-2012
		WO 2012028579 A1	08-03-2012
		ZA 201302334 B	25-09-2014
<hr/>			
WO 2008004117	A1 10-01-2008	AR 061846 A1	24-09-2008
		TW 200813048 A	16-03-2008
		US 2008090834 A1	17-04-2008
		WO 2008004117 A1	10-01-2008
<hr/>			
WO 0226731	A2 04-04-2002	AU 1128102 A	08-04-2002
		EP 1322637 A2	02-07-2003
		US 2004077690 A1	22-04-2004
		WO 0226731 A2	04-04-2002
<hr/>			
WO 2014114779	A1 31-07-2014	CN 104955456 A	30-09-2015
		EP 2948147 A1	02-12-2015
		JP 2016505063 A	18-02-2016
		US 2015368231 A1	24-12-2015
		WO 2014114779 A1	31-07-2014
<hr/>			

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2016/072629
---

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D271/113 ADD.
--

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationsymbole)  
C07D

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2012/126932 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; AHRENS HARTMUT [DE]; BRAU) 27. September 2012 (2012-09-27) in der Anmeldung erwähnt Seite 9, Zeilen 15-22. Seite 28, Beispiel 2.; Seite 9 -----	1-11
X	WO 2013/064459 A1 (BAYER IP GMBH [DE]) 10. Mai 2013 (2013-05-10) Seite 20, Zeilen 1-6. Seite 37, Beispiel 1 -----	1-11
A	WO 2013/124228 A1 (BAYER IP GMBH [DE]) 29. August 2013 (2013-08-29) Seite 44, Schritt 2. ----- -/--	1-11

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen  Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :	
*A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist	*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldeatum oder dem Prioritätsatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kolliert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
*E* frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldeatum veröffentlicht worden ist	*X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
*L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)	*V* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
*O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht	*&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist
*P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldeatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsatum veröffentlicht worden ist	

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Abeendeatum des internationalen Recherchenberichts
7. November 2016	16/11/2016
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter  Von Daacke, Axel

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2016/072629
---

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 2012/130780 A1 (HOFFMANN LA ROCHE [CH]; HERMANN JOHANNES CORNELIUS [US]; LOWRIE JR LEE) 4. Oktober 2012 (2012-10-04) Beispiel 37 -----	1
A	WO 2012/028579 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; BRAUN RALF [DE]; KOEHN ARNIM [DE]; VAN ALMS) 8. März 2012 (2012-03-08) Seite 32, Schritt 5. -----	1
A	GOSWAMI S ET AL: "Molecular Recognition: Hydrogen bonding induced configurational locking of a new Photoresponsive receptor by Dicarboxylic acids", TETRAHEDRON LETTERS, PERGAMON, GB, Bd. 40, Nr. 9, 26. Februar 1999 (1999-02-26), Seiten 1735-1738, XP004157179, ISSN: 0040-4039, DOI: 10.1016/S0040-4039(98)02678-1 Schema 1. -----	1
A	ALIASGHAR JARRAHPOUR ET AL: "Synthesis of some new monocyclic [beta]-lactams as antimalarial agents", IRANIAN CHEMICAL SOCIETY. JOURNAL, Bd. 12, Nr. 12, 27. Juni 2015 (2015-06-27), Seiten 2083-2092, XP055235675, IR ISSN: 1735-207X, DOI: 10.1007/s13738-015-0685-x Schema 3, Reaktion von 4d nach 5d. -----	1
A	WO 2008/004117 A1 (PFIZER PROD INC [US]; HOOVER DENNIS JAY [US]; WITTER KEVIN G [US]) 10. Januar 2008 (2008-01-10) Seite 94, Preparation 11A. -----	1
A	WO 02/26731 A2 (COR THERAPEUTICS INC [US]; ZHU BING YAN [US]; HUANG WENRONG [US]; ZHAN) 4. April 2002 (2002-04-04) Beispiel 4 -----	1
A	WO 2014/114779 A1 (LUNDBECK & CO AS H [DK]) 31. Juli 2014 (2014-07-31) Seite 28, Schema 4. Seite 45, Y44. -----	1

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2016/072629

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2012126932 A1 27-09-2012	AR 085469 A1 AU 2012230388 A1 BR 112013023911 A2 CA 2830773 A1 CN 103596946 A DK 2688885 T3 EA 201391320 A1 EP 2688885 A1 JP 2014510088 A KR 20140027953 A SI 2688885 T1 US 2014080705 A1 WO 2012126932 A1 ZA 201307815 B		02-10-2013 03-10-2013 09-08-2016 27-09-2012 19-02-2014 12-09-2016 28-02-2014 29-01-2014 24-04-2014 07-03-2014 28-10-2016 20-03-2014 27-09-2012 29-04-2015
WO 2013064459 A1 10-05-2013	AR 088615 A1 AU 2012331283 A1 CA 2854060 A1 CN 104024235 A EP 2773626 A1 HK 1201272 A1 JP 5982004 B2 JP 2014532679 A KR 20140091034 A RU 2014122431 A US 2014309112 A1 WO 2013064459 A1		25-06-2014 22-05-2014 10-05-2013 03-09-2014 10-09-2014 28-08-2015 31-08-2016 08-12-2014 18-07-2014 10-12-2015 16-10-2014 10-05-2013
WO 2013124228 A1 29-08-2013	AR 090091 A1 CN 104125949 A EP 2817296 A1 JP 2015508766 A US 2015018209 A1 WO 2013124228 A1		15-10-2014 29-10-2014 31-12-2014 23-03-2015 15-01-2015 29-08-2013
WO 2012130780 A1 04-10-2012	CA 2828824 A1 EP 2691399 A1 ES 2588680 T3 JP 6001048 B2 JP 2014512347 A KR 20140020972 A RU 2013145299 A US 2012252777 A1 WO 2012130780 A1		04-10-2012 05-02-2014 04-11-2016 05-10-2016 22-05-2014 19-02-2014 10-05-2015 04-10-2012 04-10-2012
WO 2012028579 A1 08-03-2012	AR 082828 A1 AU 2011298424 A1 BR 112013005070 A2 CA 2809487 A1 CN 103282354 A CO 6670599 A2 DK 2611785 T3 EA 201390265 A1 EP 2611785 A1 ES 2503815 T3 HR P20140779 T1 IL 224757 A JP 5805767 B2		09-01-2013 21-03-2013 26-04-2016 08-03-2012 04-09-2013 15-05-2013 25-08-2014 30-08-2013 10-07-2013 07-10-2014 07-11-2014 30-06-2015 10-11-2015

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2016/072629

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
		JP 2013536817 A	26-09-2013
		KR 20130101506 A	13-09-2013
		PT 2611785 E	09-09-2014
		TW 201221059 A	01-06-2012
		UA 109150 C2	27-07-2015
		US 2012058892 A1	08-03-2012
		UY 33583 A	30-03-2012
		WO 2012028579 A1	08-03-2012
		ZA 201302334 B	25-09-2014
<hr/>			
WO 2008004117 A1	10-01-2008	AR 061846 A1	24-09-2008
		TW 200813048 A	16-03-2008
		US 2008090834 A1	17-04-2008
		WO 2008004117 A1	10-01-2008
<hr/>			
WO 0226731 A2	04-04-2002	AU 1128102 A	08-04-2002
		EP 1322637 A2	02-07-2003
		US 2004077690 A1	22-04-2004
		WO 0226731 A2	04-04-2002
<hr/>			
WO 2014114779 A1	31-07-2014	CN 104955456 A	30-09-2015
		EP 2948147 A1	02-12-2015
		JP 2016505063 A	18-02-2016
		US 2015368231 A1	24-12-2015
		WO 2014114779 A1	31-07-2014
<hr/>			

---

フロントページの続き

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,R0,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JP,KE,KG,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA

(74)代理人 100137213

弁理士 安藤 健司

(74)代理人 100143823

弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100151448

弁理士 青木 孝博

(74)代理人 100196483

弁理士 川寄 洋祐

(74)代理人 100203035

弁理士 五味渕 琢也

(74)代理人 100185959

弁理士 今藤 敏和

(74)代理人 100160749

弁理士 飯野 陽一

(74)代理人 100160255

弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100202267

弁理士 森山 正浩

(74)代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812

弁理士 城山 康文

(72)発明者 フンケ, クリストゥイアン

ドイツ国、42799・ライヒリンゲン、ヘルシャイト・7

(72)発明者 ネーフ, アルント

ドイツ国、51399・ブルシャイト、ボルンハイム・19アー

(72)発明者 パツエノク, セルギー

ドイツ国、42699・ゾーリンゲン、ヴィッペラウアー・シュトラーセ・57

(72)発明者 ルイ, ノルベルト

ドイツ国、51519・オーデンタール、アム・ゲウス・ガルテン・2

F ターム(参考) 4C056 AA01 AB02 AC07 AD01 AE03 AF06 FA03 FB12 FC01