

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2023年8月3日(03.08.2023)



(10) 国際公開番号

WO 2023/145372 A1

(51) 国際特許分類:
C07C 231/10 (2006.01) C07C 237/06 (2006.01)

岡市向野本町300 日本曹達株式会社
高岡工場内 Toyama (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2022/048272

(74) 代理人: 松沼 泰史, 外(MATSUNUMA Yasushi
et al.); 〒1006620 東京都千代田区丸の内一
丁目9番2号 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2022年12月27日(27.12.2022)

(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 2022-011981 2022年1月28日(28.01.2022) JP

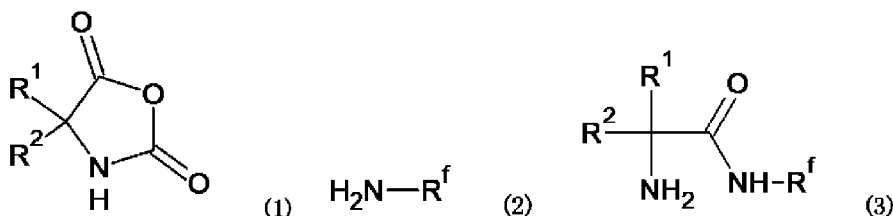
(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保
護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ,
BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CL, CN, CO, CR, CU, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP,
KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK,
LR, LS, LU, LY, MA, MD, 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, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

(71) 出願人: 日本曹達株式会社(NIPPON SODA CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒1008165 東京都千代田区大
手町二丁目2番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 野田 薫(NODA Kaoru); 〒9338507 富
山県高岡市向野本町300 日本曹達株
式会社 高岡工場内 Toyama (JP). 武久 克
磨(TAKEHISA Katsuma); 〒9338507 富山県高

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING AMIDE COMPOUND

(54) 発明の名称: アミド化合物の製造方法



(57) **Abstract:** The present invention provides a method for producing a compound represented by formula (3) (wherein R^1 and R^2 each independently represent a hydrogen atom or a C1-C6 alkyl group and R^f is a C1-C6 alkyl group containing a fluorine atom), e.g., 2-amino-2-methyl-N-(2,2,2-trifluoroethyl)propanamide, and/or a salt thereof, the method comprising chemically reacting a compound represented by formula (1) (wherein R^1 and R^2 have the same meanings as in formula (3)), e.g., 4,4-dimethyl-1,3-oxazolidine-2,5-dione, with a compound represented by formula (2) (wherein R^f has the same meaning as in formula (3)), e.g., 2,2,2-trifluoroethylamine, and/or a salt thereof.

(57) 要約: 本発明は、4, 4-ジメチル-1, 3-オキサゾリジン-2, 5-ジオンなどの式(1) (式(1)中、 R^1 および R^2 は、それぞれ独立して、水素原子またはC1~6アルキル基を示す。)で表される化合物と、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミンなどの式(2) (式(2)中、 R^f は、フッ素原子含有C1~6アルキル基である。)で表される化合物および/またはその塩と、を化学反応させることを含む、2-アミノ-2-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)プロパンアミドなどの式(3) (式(3)中、 R^1 および R^2 は、式(1)中のものと同じであり、 R^f は、式(2)中のものと同じである。)で表される化合物および/またはその塩の製造方法を提供する。

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第21条(3))

明 細 書

発明の名称： アミド化合物の製造方法

技術分野

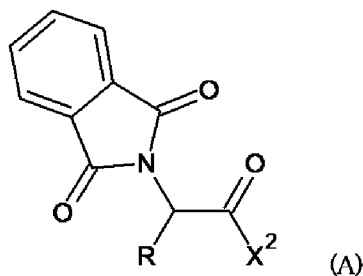
[0001] 本発明は、アミド化合物の製造方法に関する。より詳細に、本発明は、 α -アミノ-N-(フッ素原子含有アルキル)アルカンアミド化合物の製造方法に関する。

背景技術

[0002] 2-アミノ-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アセトアミド又はその塩は、医薬農薬の中間体等として有用な化合物である。

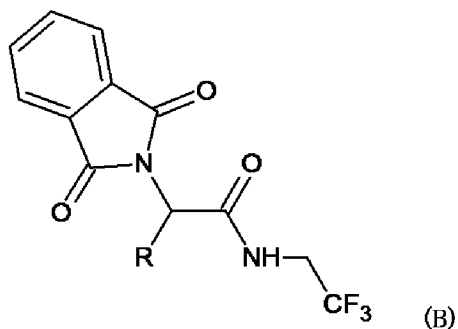
[0003] 2-アミノ-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アセトアミドを製造する方法として、例えば、特許文献1は、無機塩基の存在下に、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミンまたはその塩と、式(A)で表されるアシル化合物と、を化学反応させることによる、式(B)で表されるN-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アセトアミド化合物を得、フタルイミド部分を脱保護することによる2-アミノ-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アセトアミドの製造方法を開示している。

[0004] [化1]



[0005]

[化2]

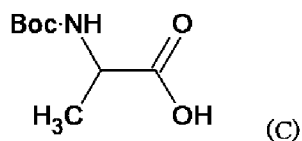


(式(A)中、 X^2 はアルコキシ基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子などである。

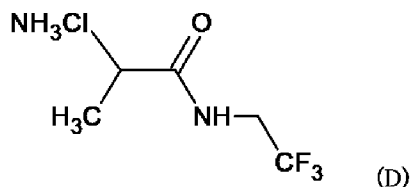
式(A)および(B)中、Rは水素原子またはメチル基である。)

[0006] 特許文献2は、式(C)で表される化合物と、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミン塩酸塩とを、化学反応させることにより、式(D)で表される化合物(2-アミノ-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)プロパンアミド塩酸塩)を製造したことを開示している。特許文献3にも同様なスキームにより、2-アミノ-2-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)プロパンアミド塩酸塩を製造したことを開示している。

[0007] [化3]



[0008] [化4]



[0009] ところで、アミノ酸N-カルボン酸無水物は、分子中に存在するアミノ基が保護されていることから、極めて有用な中間体である。アミノ酸N-カルボン酸無水物中の酸無水物基は活性が高く、任意の求核単位と反応させることができ、例えば、アミノ基と化学反応させてアミド基を得ることができる。アミノ酸N-カルボン酸無水物はアミン類を作用させると開環重合反応を

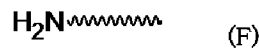
開始する。

[0010] 例えば、非特許文献 1 は、式(E)で表される化合物に、式(F)で表されるアミン化合物を作用させることにより、式(E)で表される化合物が開環重合反応して、式(G)で表されるポリペプチドが製造されたことを開示している。

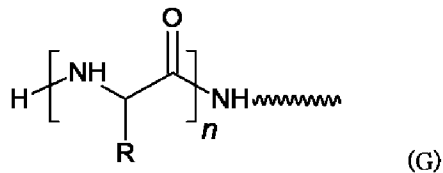
[0011] [化5]



[0012] [化6]



[0013] [化7]

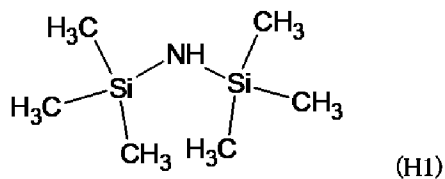


[0014] 非特許文献 2 は、3-メチル-1, 3-オキサゾリジン-2, 5-ジオンに、開始剤として 2, 2-ジメチルプロパン-1-アミンを作用させることにより、3-メチル-1, 3-オキサゾリジン-2, 5-ジオンが開環重合反応して、末端に開始剤残基の結合したポリペプチドが製造されたことを開示している。

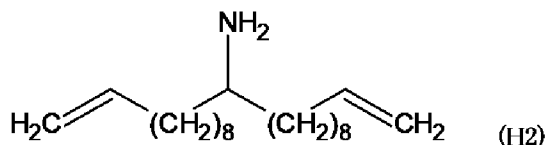
[0015] 非特許文献 3 は、4, 4-ジメチル-1, 3-オキサゾリジン-2, 5-ジオンに、開始剤として、式(H1)で表される化合物、式(H2)で表される化合物または式(H3)で表される化合物を作用させると、4, 4-ジメチル-1, 3-オキサゾリジン-2, 5-ジオンが開環重合反応して、末端に開始剤残基の結合したポリペプチドが製造されたことを開示している。

[0016]

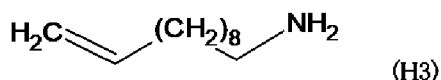
[化8]



[0017] [化9]



[0018] [化10]



[0019] 非特許文献4は、N-カルボキシアミノ酸無水物の重合反応を抑制できないかを種々検討した結果、N-カルボキシアミノ酸無水物をアミン類と反応させる場合、アミンの塩基度、N-カルボキシアミノ酸無水物のNHの塩基度および反応後生成したペプチドのNH₂の塩基度もしくはN-カルボキシアミノ酸無水物の置換基の立体障害が反応に影響すると、述べている。

先行技術文献

特許文献

[0020] 特許文献1：特開2009-173621号公報

特許文献2：WO 2006/127587 A1

特許文献3：WO 2019/198592 A1

非特許文献

[0021] 非特許文献1：遠藤ら「ホスゲンフリー法による α -アミノ酸N-カルボン酸無水物(NCA)の合成法の開発とポリペプチド合成への展開」日本接着学会誌 VOL. 52, NO. 11, (2016) 333(10)-341(18)

非特許文献2：Olga Schafer et al. "Combining Orthogonal Reactive Groups in Block Copolymers for Functional Nanoparticle Synthesis in a Singl

e Step” ACS Macro Lett. 2017, 6, 1140-1145

非特許文献3: Jan Freudenberget al. "Chirality Control of Screw-Sense in Aib-Polymers: Synthesis and Helicity of Amino Acid Functionalized Polymers" ACS Macro Lett. 2020, 9, 686-692

非特許文献4: 大屋ら「N-カルボキシアミノ酸無水物を用いるアシル化反応」有機合成化学 第29巻第8号 (1971) 751(15)-759(23)

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0022] 本発明の目的は、 α -アミノ-N-(フッ素原子含有アルキル)アルカンアミド化合物の製造方法を提供することである。

課題を解決するための手段

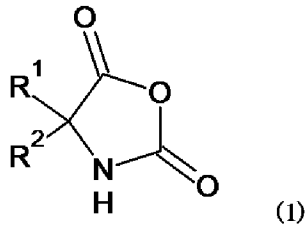
[0023] 非特許文献1、非特許文献2または非特許文献3に記載されているとおりの反応機構であるならば、仮に、式(1)で表される化合物(以下、化合物(1)ということがある。)に式(2)で表される化合物(以下、化合物(2)ということがある。)を作用させると、化合物(1)が開環重合反応して、対応する構造のポリペプチドが生成し、化合物(3)を得ることできないであろうと、推定できる。

ところが、実際に、化合物(1)に化合物(2)を作用させると、ポリペプチドは生成せず、式(3)で表される化合物(以下、化合物(3)ということがある。)を得ることができた。この事実に基づき、本発明の目的を達成するために検討した結果、以下の態様を包含する本発明を完成するに至った。

[0024] [1] 式(1)で表される化合物と、
式(2)で表される化合物およびその塩からなる群より選ばれる少なくとも1種と、
を化学反応させることを含む、式(3)で表される化合物および／またはその塩の製造方法。

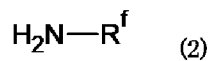
[0025]

[化11]



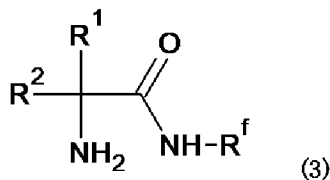
(式(1)中、 R^1 および R^2 は、それぞれ独立して、水素原子またはC 1～6 アルキル基である。)

[0026] [化12]



(式(2)中、 R^f は、フッ素原子含有C 1～6 アルキル基である。)

[0027] [化13]



(式(3)中、 R^1 および R^2 は、式(1)中のものと同じであり、 R^f は、式(2)中のものと同じである。)

[0028] [2] 式(1)および式(3)中の R^1 および R^2 がそれぞれ独立してC 1～6 アルキル基である、[1] に記載の製造方法。

[3] 式(2)で表される化合物が2, 2, 2-トリフルオロエチルアミンである、[1] または[2] に記載の製造方法。

発明の効果

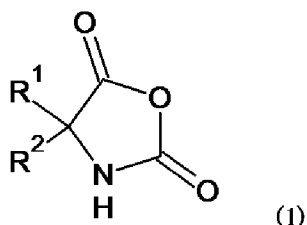
[0029] 本発明の製造方法によれば、化合物(3)を高収率で得ることができる。本発明の効果の要因は定かでないが、化合物(2)の求核性が化合物(3)の求核性よりも優勢であるから、または化合物(2)中のフッ素原子による立体障害があるからではないかと考える。

発明を実施するための形態

[0030] 本発明の化合物(3)および／またはその塩の製造方法は、化合物(1)と化合物(2)および／またはその塩とを化学反応させることを含む。

[0031] 本発明に用いられる化合物(1)は、式(1)で表される。

[0032] [化14]



[0033] 式(1)中、R¹およびR²は、それぞれ独立して、水素原子またはC 1～6 アルキル基である。

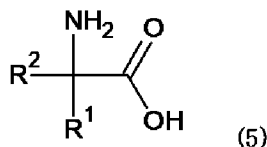
R¹およびR²におけるC 1～6 アルキル基は、直鎖であってもよいし、分岐鎖であってもよい。C 1～6 アルキル基としては、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*n*-ブチル基、*n*-ペンチル基、*n*-ヘキシル基、*i*-プロピル基、*i*-ブチル基、*s*-ブチル基、*t*-ブチル基、*i*-ペンチル基、ネオペンチル基、2-メチルブチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、*i*-ヘキシル基などを挙げることができる。

[0034] 本発明に用いられる化合物(1)は、公知の方法で自ら合成したものであってもよいし、他の者が何らかの方法で合成し市販しているものであってもよい。

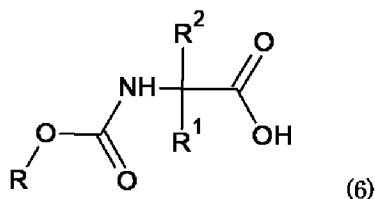
[0035] 化合物(1)は、例えば、式(5)で表される化合物（以下、化合物(5)ということがある。）をホスゲン、ジホスゲン、又はトリホスゲンと反応させることを含む方法、式(6)で表される化合物（以下、化合物(6)ということがある。）をハロゲン化試薬と反応させ、Rのハロゲン化物を脱離させることを含む方法、化合物(5)をジ-*tert*-ブチルトリカーボナートと反応させることを含む方法、化合物(5)を炭酸ジアリールと反応させることを含む方法などによって、得ることができる。

[0036]

[化15]



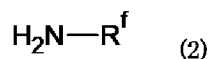
[0037] [化16]



(式(5)および(6)中、 R^1 および R^2 は、式(1)中のものと同じである。式(6)中、 R は、水素原子またはハロゲン化物を形成し得る有機基である。)

[0038] 本発明に用いられる化合物(2)は、式(2)で表される。

[0039] [化17]

[0040] 式(2)中、 R^f は、フッ素原子含有C 1～6アルキル基である。

フッ素原子含有C 1～6アルキル基としては、例えば、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、1-フルオロエチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、1, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、パーフルオロエチル基、1, 2-ジフルオロ-n-プロピル基、3, 3, 3-トリフルオロ-n-プロピル基、1-フルオロ-n-ブチル基、1-トリフルオロメチル-1-メチル-エチル基、パーフルオロ-n-ペンチル基、パーフルオロ-n-ヘキシル基などを挙げることができる。

[0041] 化合物(2)の塩としては、塩化水素酸塩、フッ化水素酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、スルホン酸塩、硫酸塩、炭酸塩、酢酸塩などを挙げることができる。

[0042] 本発明に用いられる化合物(2)およびその塩は、公知の方法で自ら合成した

ものであってもよいし、他の者が何らかの方法で合成し市販しているものであってもよい。

[0043] 化合物(1)と化合物(2)および／またはその塩との化学反応（以下、単に「アミド化反応」と呼ぶことがある。）における、化合物(2)および／またはその塩の量は特に限定されないが、化合物(1) 100モル部に対して、好ましくは100～1000モル部、より好ましくは150～300モル部である。

[0044] アミド化反応は、水、有機溶媒、イオン液体などの溶媒中で行うことができる。有機溶媒は、当該化学反応に対して不活性であることが好ましい。有機溶媒としては、例えば、メタノール、エタノールなどのアルコール類；ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル（製品名：ジグライム）、テトラヒドロフラン（略名：THF）、ジオキサンなどのエーテル類；ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン（略名：DCE）などのハロゲン化炭化水素類；ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン、ヘプタン、オクタンなどの脂肪族炭化水素類；トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素類；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル、酢酸ブチル、炭酸ジメチル、炭酸ジエチルなどのエステル類；アセトン、アノン、メチルイソブチルケトン（略名：MIBK）などのケトン類；その他溶媒としてジメチルスルホキシド（略名：DMSO）、ジメチルホルムアミド（略名：DMF）などを挙げることができる。溶媒の使用量は特に限定されないが、化合物(1) 1重量部に対して、好ましくは0.5～500重量部である。

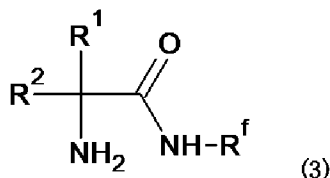
[0045] 反応基質の混合順序は、特に制限はないが、例えば、反応容器に溶媒を入れた後、化合物(2)および／またはその塩を加え、化合物(1)を加えることができ、または反応容器に溶媒を入れた後、化合物(1)を加え、化合物(2)および／またはその塩を加えることができる。混合させるときの温度は、特に制限されず、室温でもよい。反応基質の混合は、攪拌下で行うことが好ましい。

[0046] アミド化反応の際の温度は、適宜選択可能であるが、例えば、0℃から溶

媒の沸点である。アミド化反応の際の圧力は、特に制限されず、例えば、常圧である。反応時間は、例えば、0.5時間～24時間である。

[0047] 本発明の製造方法で得られる化合物(3)は、式(3)で表される。

[0048] [化18]



(式(3)中、 R^1 および R^2 は、式(1)中のものと同じであり、 R^f は、式(2)中のものと同じである。)

[0049] 化合物(3)の塩としては、塩化水素酸塩、フッ化水素酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、スルホン酸塩、硫酸塩、炭酸塩、酢酸塩などを挙げることができる。

[0050] アミド化反応終了後に後処理を行ってもよい。例えば、有機溶媒で抽出し、得られる有機層を乾燥、濃縮するなどの処理をすることができる。さらに、再結晶、クロマトグラフィーなどの操作により精製することができる。

[0051] 以下に、実施例を示して、本発明をより具体的に説明する。なお、本発明は、下記の実施例によって限定されるものではない。

[0052] [実施例1] 2-アミノ-2-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)プロパンアミドの合成

4,4-ジメチルオキサゾリジン-2,5-ジオン(1.3g、10mmol)に対して酢酸エチルを10mL加えた。この溶液に2,2,2-トリフルオロエチルアミン(1.0g、12mmol)を滴下し、20℃で24時間反応させた。この溶液を濃縮乾固し、2-アミノ-2-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)プロパンアミドを90%収率で得た。得られた物質のNMRは以下のとおりであった。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , δ (ppm)) : 8.17(s, 1H), 3.83-3.92(m, 2H), 1.50(s, 2H), 1.38(s, 6H)

[0053] [実施例2] 2-アミノ-2-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロ

エチル) プロパンアミドの合成

酢酸エチル 100 mL に対し 2, 2, 2-トリフルオロエチルアミン (51.5 g、0.61 mol) を添加した。この溶液に 4, 4-ジメチルオキサゾリン-2, 5-ジオン (32.7 g、0.26 mol) を酢酸エチル 150 mL に溶解させた溶液を滴下し、室温で 2 時間反応させた。この溶液を濃縮乾固し、2-アミノ-2-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル) プロパンアミドを 46.7 g、98% 収率で得た。得られた物質の NMR は以下のとおりであった。

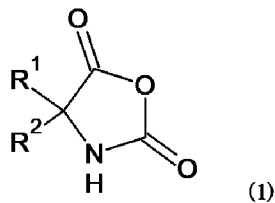
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3/TMS , δ (ppm)) 8.17 (s, 1H), 3.83–3.92 (m, 2H), 1.50 (s, 2H), 1.38 (s, 6H) M.P. 91–93°C

請求の範囲

[請求項1]

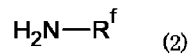
式(1)で表される化合物と、
 式(2)で表される化合物およびその塩からなる群より選ばれる少なくとも1種と、
 を化学反応させることを含む、式(3)で表される化合物またはその塩の製造方法。

[化1]



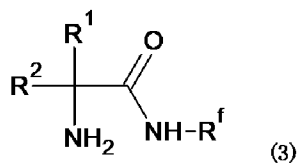
(式(1)中、 R^1 および R^2 は、それぞれ独立して、水素原子またはC 1～6アルキル基である。)

[化2]



(式(2)中、 R^f は、フッ素原子含有C 1～6アルキル基である。)

[化3]



(式(3)中、 R^1 および R^2 は、式(1)中のものと同じであり、 R^f は、式(2)中のものと同じである。)

[請求項2]

式(1)および式(3)中の R^1 および R^2 がそれぞれ独立してC 1～6アルキル基である、請求項1に記載の製造方法。

[請求項3]

式(2)で表される化合物が2, 2, 2-トリフルオロエチルアミンである、請求項1または2に記載の製造方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2022/048272

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**C07C 231/10**(2006.01)i; **C07C 237/06**(2006.01)i

FI: C07C231/10; C07C237/06

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)

C07C231/10; C07C237/06

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

Published examined utility model applications of Japan 1922-1996
 Published unexamined utility model applications of Japan 1971-2023
 Registered utility model specifications of Japan 1996-2023
 Published registered utility model applications of Japan 1994-2023

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

CAPLUS/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2019/198592 A1 (NIPPON SODA CO., LTD.) 17 October 2019 (2019-10-17) paragraph [0176], example 2, compound 18	1-3
Y	JP 2017-509688 A (F. HOFFMANN-LA ROCHE AG) 06 April 2017 (2017-04-06) paragraphs [0136], [0137], [0144], [0145]	1-2
A		3
Y	JP 2009-173621 A (NISSAN CHEM. IND., LTD.) 06 August 2009 (2009-08-06) claims, examples 3-5, 7	1, 3
A		2
Y	JP 2013-537914 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.) 07 October 2013 (2013-10-07) claims, examples 1, 3	1, 3
A		2
Y	JP 2008-545660 A (VERTEX PHARMACEUTICALS INC.) 18 December 2008 (2008-12-18) paragraphs [0277], [0278]	1, 3
A		2

☒ 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

21 February 2023

Date of mailing of the international search report

07 March 2023

Name and mailing address of the ISA/JP

Japan Patent Office (ISA/JP)
 3-4-3 Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915
 Japan

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2022/048272

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	US 8349899 B1 (ARROWHEAD CENTER, INC.) 08 January 2013 (2013-01-08) claims, examples 10, 11, 14	1-3
Y	KNOBLER, Y. et al. Reaction of N -Carboxy- α -Amino-acid Anhydrides with Hydrochlorides of Hydroxylamine, O-Alkylhydroxylamines, and Amines; Syntheses of Amino-hydroxamic Acids, Amido-oxy-peptides, and α -Amino-acid Amides. Journal of the Chemical Society. 1964, pp. 3941-3951 page 3941, drawings, Amino-acid amides; Basicity and Steric Factors, General Procedure for the Preparation of Amino-acid amide Hydrochlorides (VIII) and of amino-acid amide (IX)	1-3
Y	HARMANDA, L. et al. Recyclable catalyst for the asymmetric Henry reaction based on functionalized imidazolidine-4-one-copper(II) complexes supported by a polystyrene copolymer. Tetrahedron Letters. 2015, vol. 56, no. 45, pp. 6240-6243 scheme 1, compound 2	1-3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/JP2022/048272

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
WO	2019/198592	A1	17 October 2019	US 2021/0051960 A1 paragraph [0488], example 2, compound 18 EP 3778563 A1 KR 10-2020-0106212 A	
JP	2017-509688	A	06 April 2017	US 2016/0376237 A1 paragraphs [0246], [0247], [0258], [0259] WO 2015/150438 A1 EP 3126349 A1 KR 10-2016-0132495 A CN 106458984 A	
JP	2009-173621	A	06 August 2009	(Family: none)	
JP	2013-537914	A	07 October 2013	US 2013/0267729 A1 claims, examples 1, 3 WO 2012/047543 A1 EP 2621894 A1 CN 103124721 A KR 10-2013-0099121 A	
JP	2008-545660	A	18 December 2008	US 2007/0135466 A1 paragraphs [0356], [0357] WO 2006/127587 A1 EP 1881983 A1 KR 10-2008-0016659 A CN 101228161 A	
US	8349899	B1	08 January 2013	(Family: none)	

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC）） C07C 231/10(2006.01)i; C07C 237/06(2006.01)i FI: C07C231/10; C07C237/06										
B. 調査を行った分野										
調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC）） C07C231/10; C07C237/06										
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの <table border="0"> <tr> <td>日本国実用新案公報</td> <td>1922 - 1996年</td> </tr> <tr> <td>日本国公開実用新案公報</td> <td>1971 - 2023年</td> </tr> <tr> <td>日本国実用新案登録公報</td> <td>1996 - 2023年</td> </tr> <tr> <td>日本国登録実用新案公報</td> <td>1994 - 2023年</td> </tr> </table>			日本国実用新案公報	1922 - 1996年	日本国公開実用新案公報	1971 - 2023年	日本国実用新案登録公報	1996 - 2023年	日本国登録実用新案公報	1994 - 2023年
日本国実用新案公報	1922 - 1996年									
日本国公開実用新案公報	1971 - 2023年									
日本国実用新案登録公報	1996 - 2023年									
日本国登録実用新案公報	1994 - 2023年									
国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語） CAplus/REGISTRY (STN)										
C. 関連すると認められる文献										
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号								
Y	WO 2019/198592 A1（日本曹達株式会社）17.10.2019（2019 - 10 - 17） [0176]、実施例 2、化合物 18	1-3								
Y	JP 2017-509688 A（エフ・ホフマン・ラ ロシュ アーゲー）06.04.2017（2017 - 04 - 06） [0136]-[0137]、[0144]-[0145]	1-2								
A		3								
Y	JP 2009-173621 A（日産化学工業株式会社）06.08.2009（2009 - 08 - 06） 特許請求の範囲、実施例 3 - 5、7	1, 3								
A		2								
Y	JP 2013-537914 A（イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・アンド・カンパニー） 07.10.2013（2013 - 10 - 07） 特許請求の範囲、実施例 1、3	1, 3								
A		2								
☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。 ☒ パテントファミリーに関する別紙を参照。										
* 引用文献のカテゴリー “A” 特に関連のある文献ではなく、一般的な技術水準を示すもの “E” 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの “L” 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す） “O” 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 “P” 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献 “T” 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と抵触するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの “X” 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの “Y” 特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの “&” 同一パテントファミリー文献										
国際調査を完了した日 21.02.2023		国際調査報告の発送日 07.03.2023								
名称及びあて先 日本国特許庁(ISA/JP) 〒100-8915 日本国 東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号		権限のある職員（特許庁審査官） 中島 芳人 4H 2587 電話番号 03-3581-1101 内線 3443								

C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
Y	JP 2008-545660 A (パーテックス ファーマシューティカルズ インコーポレイテッド) 18.12.2008 (2008 - 12 - 18) [0277]-[0278]	1, 3
A		2
Y	US 8349899 B1 (ARROWHEAD CENTER, INC.) 08.01.2013 (2013 - 01 - 08) Claims, Examples 10-11, 14	1-3
Y	KNOBLER, Y. et al., Reaction of N -Carboxy- α -Amino-acid Anhydrides with Hydrochlorides of Hydroxylamine, O-Alkylhydroxylamines, and Amines; Syntheses of Amino-hydroxamic Acids, Amido-oxy-peptides, and α -Amino-acid Amides, Journal of the Chemical Society, 1964, pp. 3941-3951 p. 3941の図, Amino-acid amides; Basicity and Steric Factors, General Procedure for the Preparation of Amino-acid amide Hydrochlorides (VIII) and of amino-acid amide (IX)	1-3
Y	HARMANDA, L. et al., Recyclable catalyst for the asymmetric Henry reaction based on functionalized imidazolidine-4-one-copper(II) complexes supported by a polystyrene copolymer, Tetrahedron Letters, 2015, Vol. 56, No. 45, pp. 6240-6243 Scheme 1, 化合物 2	1-3

国際調査報告
 パテントファミリーに関する情報

国際出願番号

PCT/JP2022/048272

引用文献			公表日	パテントファミリー文献	公表日
WO	2019/198592	A1	17.10.2019	US 2021/0051960 A1 [0488], Example 2, Compound 18 EP 3778563 A1 KR 10-2020-0106212 A	
JP	2017-509688	A	06.04.2017	US 2016/0376237 A1 [0246]-[0247], [0258]- [0259] WO 2015/150438 A1 EP 3126349 A1 KR 10-2016-0132495 A CN 106458984 A	
JP	2009-173621	A	06.08.2009	(ファミリーなし)	
JP	2013-537914	A	07.10.2013	US 2013/0267729 A1 Claims, Examples 1, 3 WO 2012/047543 A1 EP 2621894 A1 CN 103124721 A KR 10-2013-0099121 A	
JP	2008-545660	A	18.12.2008	US 2007/0135466 A1 [0356]-[0357] WO 2006/127587 A1 EP 1881983 A1 KR 10-2008-0016659 A CN 101228161 A	
US	8349899	B1	08.01.2013	(ファミリーなし)	