

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6182621号
(P6182621)

(45) 発行日 平成29年8月16日(2017.8.16)

(24) 登録日 平成29年7月28日(2017.7.28)

(51) Int. Cl.		F I	
C O 7 D 471/08	(2006.01)	C O 7 D	471/08
C O 7 B 61/00	(2006.01)	C O 7 B	61/00 3 0 0
C O 7 B 53/00	(2006.01)	C O 7 B	53/00 G

請求項の数 6 (全 12 頁)

(21) 出願番号	特願2015-560793 (P2015-560793)	(73) 特許権者	506224012
(86) (22) 出願日	平成25年10月12日(2013.10.12)		ウォックハート リミテッド
(65) 公表番号	特表2016-510063 (P2016-510063A)		インド マハラシュトラ 431210
(43) 公表日	平成28年4月4日(2016.4.4)		アウランガバッド チカルタナ エムアイ
(86) 国際出願番号	PCT/IB2013/059329		ディーシー インダストリアル エリア
(87) 国際公開番号	W02015/033191		ディー-4
(87) 国際公開日	平成27年3月12日(2015.3.12)	(74) 代理人	100086771
審査請求日	平成27年9月8日(2015.9.8)		弁理士 西島 孝喜
(31) 優先権主張番号	716/MUM/2013	(74) 代理人	100088694
(32) 優先日	平成25年3月8日(2013.3.8)		弁理士 弟子丸 健
(33) 優先権主張国	インド (IN)	(74) 代理人	100094569
			弁理士 田中 伸一郎
		(74) 代理人	100084663
			弁理士 箱田 篤

最終頁に続く

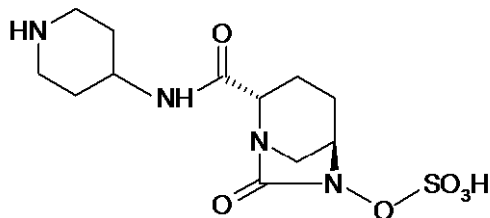
(54) 【発明の名称】 (2S, 5R) - 硫酸モノー { [(4-アミノピペリジン-4-イル) カルボニル] -7-オキソ-1, 6-ジアザ-ピシクロ [3. 2. 1] オクター-6-イル} エステルを調製するための方

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】

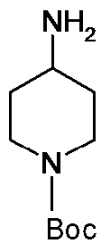


式(I)

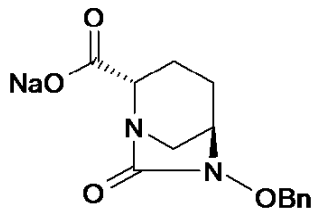
の化合物を調製するための方法であって、

(a) 式(II)の化合物を、溶媒としての水の存在下で式(III)の化合物と反応させて、式(IV)の化合物を得るステップと、ここで、Bocはtert-ブチルオキシカルボニルであり、Bnはベンジルであり、

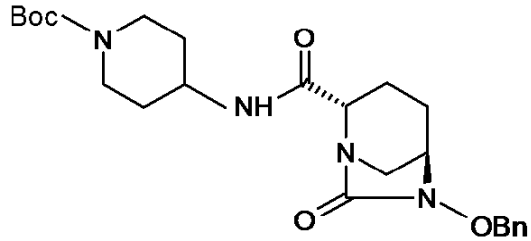
【化 2】



式 (II)



式 (III)

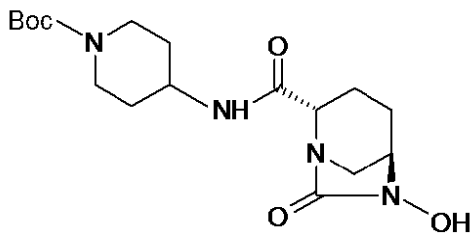


式 (IV)

10

(b) 式 (IV) の化合物を水素化分解して、式 (V)

【化 3】



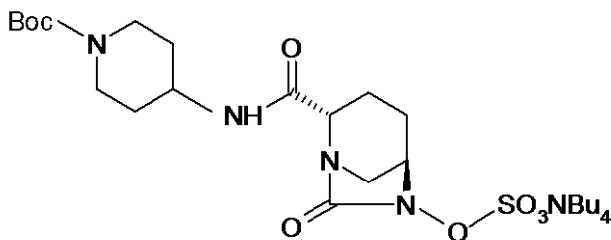
式 (V)

20

の化合物を得るステップと、ここで、Bocはtert-ブチルオキシカルボニルであり

(c) 式 (V) の化合物をスルホン化して、式 (VI)

【化 4】



式 (VI)

30

の化合物を得るステップと、ここで、Bocはtert-ブチルオキシカルボニルであり

(d) 式 (VI) の化合物を式 (I) の化合物に変換するステップとを含む、方法。

40

【請求項 2】

1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドおよび1-ヒドロキシベンゾトリアゾールの存在下で式 (II) の化合物を式 (III) の化合物と反応させることによって、式 (IV) の化合物が得られる、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

式 (IV) の化合物を水素化分解して式 (V) の化合物を得るステップが、遷移金属触媒および水素源の存在下で行われる、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

遷移金属触媒がパラジウム担持炭素であり、水素源が水素ガスである、請求項 3 に記載の方法。

50

【請求項 5】

式(V)の化合物をスルホン化して式(VI)の化合物を得るステップが、式(V)の化合物を三酸化イオウ-ピリジン錯体と反応させた後に水性テトラブチルアンモニウム硫酸水素塩で処理することによって行われる、請求項1に記載の方法。

【請求項 6】

式(VI)の化合物をトリフルオロ酢酸と反応させることによって、式(VI)の化合物が式(I)の化合物に変換される、請求項1に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

10

関連特許出願

本出願は、2013年3月8日に出願されたインド特許出願第716/MUM/2013号の利益を請求する。この出願の開示は参照によって、本明細書中に完全に書き直されたかのようにその全体を本明細書中に組み込む。この明細書中に引用された特許、特許出願および文献を含む全ての参考文献は、参照によってその全体を本明細書中に明示的に組み込む。

【0002】

本発明は、(2S, 5R)-硫酸モノ-{(4-アミノピペリジン-4-イル)カルボニル}-7-オキソ-1,6-ジアザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル}エステルを調製するための方法に関する。

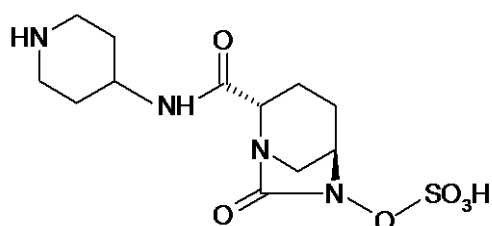
20

【背景技術】

【0003】

式(I)の化合物は、(2S, 5R)-硫酸モノ-{(4-アミノピペリジン-4-イル)カルボニル}-7-オキソ-1,6-ジアザ-ビシクロ[3.2.1]オクタ-6-イル}エステルとして化学的に知られており、抗細菌性を有する。式(I)の化合物は、MK-7655としても知られ、PCT国際特許出願PCT/US2009/031047に開示されている。

【化1】



30

式(I)

【発明の概要】

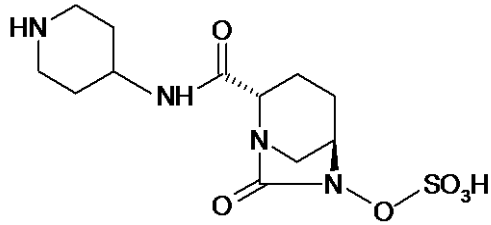
【課題を解決するための手段】

【0004】

40

1つの一般的な態様において、式(I)

【化 2】



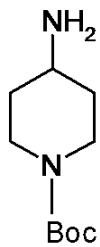
式 (I)

10

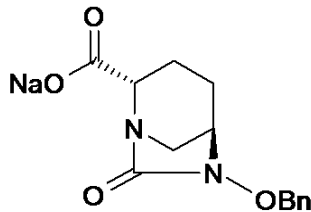
の化合物を調製するための方法であって、

(a) 式 (II) の化合物を式 (III) の化合物と反応させて、式 (IV) の化合物を得るステップと、

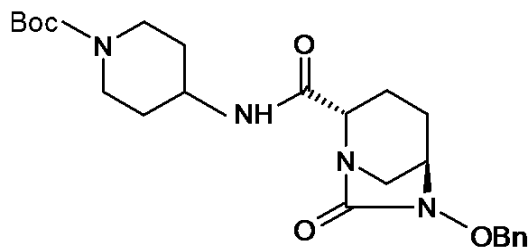
【化 3】



式 (II)



式 (III)

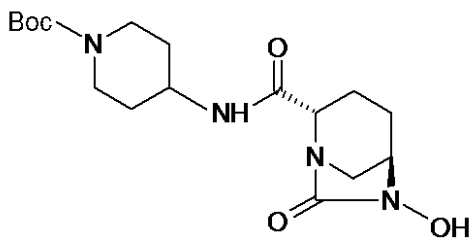


式 (IV)

20

(b) 式 (IV) の化合物を水素化分解して、式 (V)

【化 4】



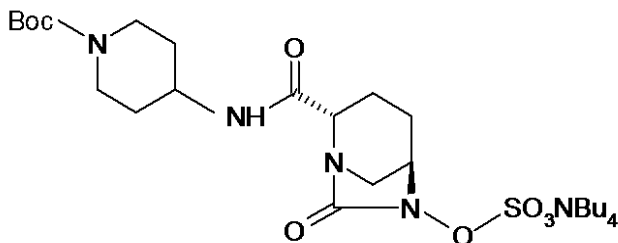
式 (V)

30

の化合物を得るステップと、

(c) 式 (V) の化合物をスルホン化して、式 (VI)

【化 5】



式 (VI)

40

の化合物を得るステップと、

50

(d) 式(VI)の化合物を式(I)の化合物に変換するステップとを含む、方法を提供する。

【0005】

本発明の1つまたは複数の実施形態の詳細を、以下の説明において示す。本発明の他の特徴、目的および利点は、特許請求の範囲を含む以下の説明から明らかとなるであろう。

【発明を実施するための形態】

【0006】

次に、例示の実施形態に言及するが、特定の用語は、本明細書中において同じものを記載するために使用するものとする。しかしながら、それによって本発明の範囲が限定されることを意図しないことを理解すべきである。当業者および本開示を入手した者に想起されるであろう、本明細書中で例示する発明の特徴の修正およびさらなる変更ならびに本明細書中に例示する本発明の原理のさらなる応用は、本発明の範囲内と考えるべきである。本明細書および添付した特許請求の範囲内で使用する単数形「1つの(a)」、「1つの(an)」および「その(the)」は、内容からそうでないことが明白に指示されない限り、複数の指示対象を含むことに留意しなければならない。本明細書中で引用した特許、特許出願および文献を含む全ての参考文献は、参照によって、本明細書中に完全に書き直されたかのようにその全体を本明細書中に明示的に組み込む。

【0007】

本明細書中で使用する用語「HOBt」は、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールを指す。

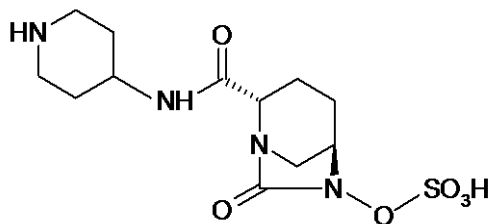
【0008】

本明細書中で使用する用語「EDC」は、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドを指す。

【0009】

1つの一般的な態様において、式(I)

【化6】

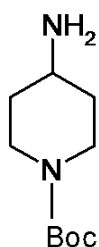


式(I)

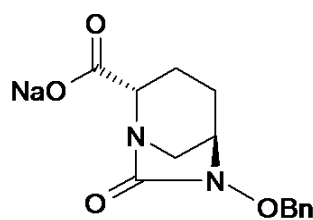
の化合物を調製するための方法であって、

(a) 式(II)の化合物を式(III)の化合物と反応させて、式(IV)の化合物を得るステップと、

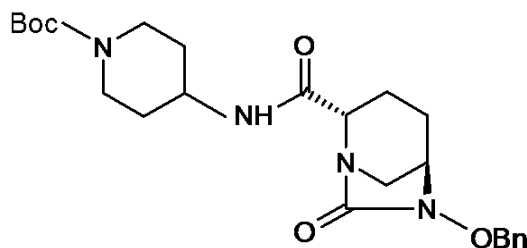
【化7】



式(II)



式(III)



式(IV)

(b) 式(IV)の化合物を水素化分解して、式(V)

10

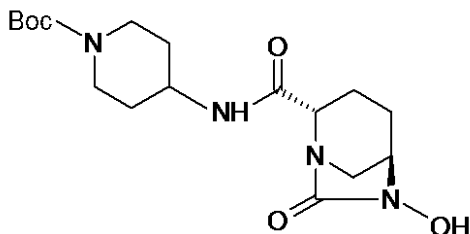
20

30

40

50

【化 8】



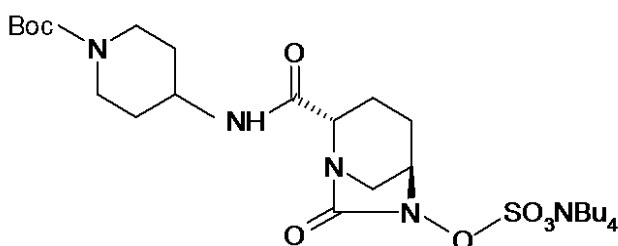
式 (V)

10

の化合物を得るステップと、

(c) 式 (V) の化合物をスルホン化して、式 (VI)

【化 9】



式 (VI)

20

の化合物を得るステップと、

(d) 式 (VI) の化合物を式 (I) の化合物に変換するステップとを含む、方法を提供する。

【0010】

式 (IV) の化合物は、式 (II) の化合物を式 (III) の化合物と反応させることによって得られる。一部の実施形態において、式 (IV) の化合物は、好適なカップリング試薬の存在下で式 (II) の化合物を式 (III) の化合物と反応させることによって得られる。一部の他の実施形態において、式 (IV) の化合物は、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールおよび1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩の存在下で式 (II) の化合物を式 (III) の化合物と反応させることによって得られる。この反応は、好適な溶媒の存在下で行い得る。一部の実施形態において、この反応は、反応溶媒としての水中で行う。

30

【0011】

式 (V) の化合物は、式 (IV) の化合物を水素化分解することによって得られる。水素化分解反応は、好適な水素化分解剤を使用して行い得る。一部の実施形態において、式 (IV) の化合物を水素化分解して式 (V) の化合物を得るステップは、遷移金属触媒および水素源の存在下で行う。一部の他の実施形態において、遷移金属触媒はパラジウム担持炭素であり、水素源は水素ガスである。一部の他の実施形態において、水素化分解反応は、好適な溶媒、例えば、メタノールの存在下で行う。一部の実施形態において、式 (IV) の化合物を水素化分解して式 (V) の化合物を得るステップは、溶媒としてのメタノール中、水素ガスの存在下で10%パラジウム担持炭素触媒を使用する。

40

【0012】

式 (VI) の化合物は、式 (V) の化合物をスルホン化することによって得られる。スルホン化反応は、好適な溶媒の存在下で行い得る。一部の実施形態において、式 (V) の化合物をスルホン化して式 (VI) の化合物を得るステップは、式 (V) の化合物を三酸化イオウ-ピリジン錯体と反応させた後にテトラブチルアンモニウム硫酸水素塩で処理す

50

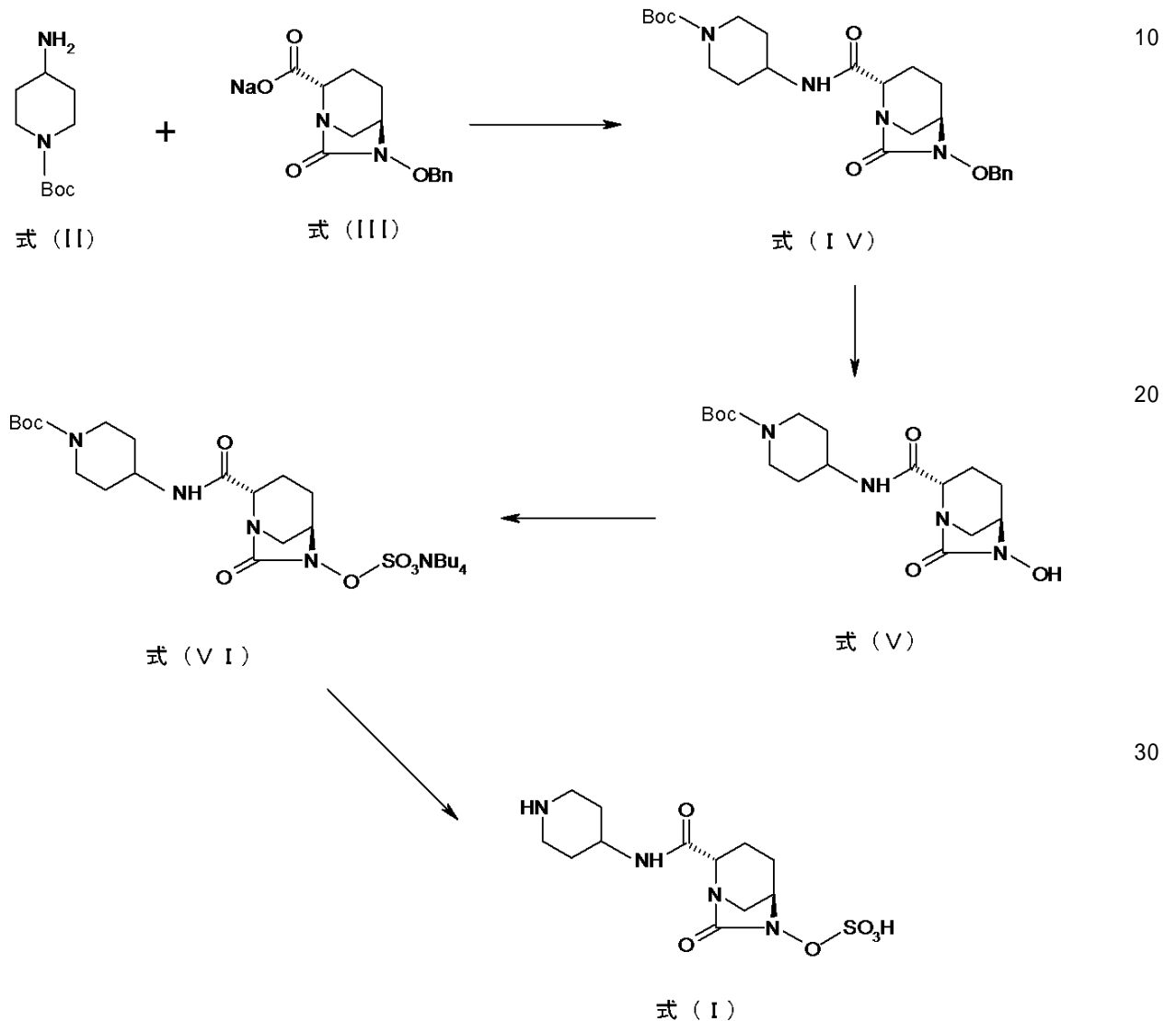
ることによって行う。

【0013】

式(VI)の化合物は、好適な試薬の存在下で式(I)の化合物に変換する。一部の実施形態において、式(VI)の化合物は、式(VI)の化合物をトリフルオロ酢酸と反応させることによって式(I)の化合物に変換する。

一部の実施形態において、式(I)の化合物は、スキーム1に記載する方法を使用して調製する。

【化10】



スキーム - 1

【0014】

本発明の範囲および精神から逸脱することなく、本明細書中に開示された本発明に種々の置換および変更を行い得ることは、当業者には容易に明らかとなるであろう。例えば、当業者ならば、記載された一般的な説明の範囲内で種々の異なる化合物を使用して、本発明を実施できることが分かるであろう。

【実施例】

【0015】

以下の実施例は、現在最もよく分かっている本発明の実施形態を例示する。しかし、以下は、本発明の原理の応用を単に代表するまたは例示するものであることを理解すべきである。当業者ならば、多くの変更ならびに代替的な組成物、方法およびシステムを、本発明の精神および範囲から逸脱することなく案出し得る。添付した特許請求の範囲は、この

10

20

30

40

50

ような変更および配列を網羅することを意図するものである。したがって、本発明を詳細に前述したが、以下の実施例は、本発明の最も实际的で好ましい実施形態であると現在考えられるものと関連して、さらなる詳細を提供するものである。

【0016】

(例1)

(2S, 5R) - 硫酸モノ - { 2 - [N ' - (4 - アミノピペリジニル) - カルボニル] - 7 - オキソ - 1 , 6 - ジアザ - ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 6 - イル } エステル (I) の調製。

ステップ - 1 : (2 S , 5 R) - t e r t - ブチル { (6 - ベンジルオキシ - 7 - オキソ - 1 , 6 - ジアザ - ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレート (I V) の調製 :

電磁攪拌機を装着した 250 ml 丸底フラスコに、30 において攪拌しながら、(2 S , 5 R) - 6 - ベンジルオキシ - 7 - オキソ - 1 , 6 - ジアザ - ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタン - 2 - カルボン酸ナトリウム (11 . 1 g , 0 . 037 mol、インド特許出願第 699 / MUM / 2013 号に開示された方法を使用して調製) の水 (180 ml) 中溶液、続いて 1 - t e r t - ブトキシカルボニル - 4 - アミノ - ピペリジン (7 . 8 g、0 . 039 mol)、EDC 塩酸塩 (11 g、0 . 055 mol) および 1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (4 . 8 g、0 . 037 mol) を逐次的に装入した。反応混合物を 30 において 24 時間攪拌して、懸濁液を得た。懸濁液を吸引濾過し、45 の温水 (40 ml) で洗浄し、真空下で乾燥後に (2 S , 5 R) - t e r t - ブチル { (6 - ベンジルオキシ - 7 - オキソ - 1 , 6 - ジアザ - ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレートを 12 . 7 g の量 (収率 74 %) で得た。

【0017】

分析

NMR: (CDCl₃) = 7.36-7.44 (m, 5H), 6.56 (d, 1H), 5.06 (d, 1H), 4.91 (d, 1H), 4.03 (br s, 1H), 3.88-3.97 (m, 2H), 3.29 (s, 1H), 3.00 (d, 1H), 2.86 (t, 2H), 2.64 (d, 1H), 2.37 (dd, 1H), 1.85-2.01 (m, 4H), 1.54-1.62 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.25-1.36 (m, 2H).

MS (ES+) C₂₄H₃₄N₄O₅ = 459.5 (M+1).

【0018】

ステップ - 2 : (2 S , 5 R) - t e r t - ブチル { (6 - ヒドロキシ - 7 - オキソ - 1 , 6 - ジアザ - ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレート (V) の調製 :

電磁攪拌機を装着した 100 ml 一口丸底フラスコに、35 において (2 S , 5 R) - t e r t - ブチル { (6 - ベンジルオキシ - 7 - オキソ - 1 , 6 - ジアザ - ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレート (9 g、19 . 5 mmol) のメタノール (90 ml) 中溶液、続いて 10% パラジウム担持炭素 (2 . 7 g) を装入した。反応混合物を、35 において 1 atm の水素圧下で 2 時間攪拌した。反応混合物をセライト床上で吸引濾過することによって、触媒を除去した。セライト床を、ジクロロメタン (50 ml) で洗浄した。合わせた濾液を 35 未満において真空下で蒸発させて、(2 S , 5 R) - t e r t - ブチル { (6 - ヒドロキシ - 7 - オキソ - 1 , 6 - ジアザ - ビシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレートを 8 . 45 g の量で得た。これは、次の反応にそのまま使用した。

【0019】

分析

NMR: (CDCl₃) = 6.60 (d, 1H), 3.88-4.10 (m, 4H), 3.78 (s, 1H), 3.20 (d, 1H), 3.90 (t, 2H), 2.80 (d, 1H), 2.46 (dd, 1H), 2.1-2.2 (m, 1H), 2.85-2.20 (m, 4H), 1.70-1.80 (m, 1H), 2.47 (s, 9H), 1.30-1.41 (m, 3H).

MS (ES+) C₁₇H₂₈N₄O₅ = 369.4 (M+1).

【0020】

ステップ - 3 : (2S, 5R) - tert - ブチル { (6 - スルホオキシ - 7 - オキソ - 1, 6 - ジアザ - ビシクロ [3.2.1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレートのテトラブチルアンモニウム塩 (VI) の調製 :

電磁攪拌機を装着した 100 ml 一口丸底フラスコに、35 において攪拌しながら、(2S, 5R) - tert - ブチル { (6 - ヒドロキシ - 7 - オキソ - 1, 6 - ジアザ - ビシクロ [3.2.1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレート (6.40 g、7.6 mmol) のジクロロメタン (90 ml) 中溶液、トリエチルアミン (9.3 ml)、続いてピリジン - 三酸化イオウ錯体 (5.4 g、34.2 mmol) を装入した。反応混合物を、35 においてさらに 4 時間攪拌した。溶媒を 40 未満において真空下で蒸発させて、残留物を得た。残留物を 0.5 N リン酸二水素カリウム水溶液 (90 ml) と共に 1 時間攪拌した。得られた溶液をジクロロメタン (2 × 100 ml) で抽出して、不純物を除去した。水性層にテトラブチルアンモニウム硫酸水素塩 (6.9 g、20.52 mmol) を加え、反応混合物を 35 において 14 時間攪拌した。これをジクロロメタン (3 × 30 ml) で抽出した。合わせた有機層を、硫酸ナトリウムで脱水し、真空下で蒸発させて、(2S, 5R) - tert - ブチル { (6 - スルホオキシ - 7 - オキソ - 1, 6 - ジアザ - ビシクロ [3.2.1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレートのテトラブチルアンモニウム塩を 8.0 g の量 (収率 62%) で得た。

【0021】

分析

NMR: (CDCl₃) = 6.64 (d, 1H), 4.36 (br s, 1H), 4.05 (br s, 2H), 3.90-4.00 (m, 1H), 3.87 (d, 1H), 2.28-3.34 (m, 10H), 3.80-3.95 (m, 2H), 3.74 (d, 1H), 2.42 (dd, 1H), 2.15-2.24 (m, 1H), 1.82-1.97 (m, 4H), 1.61-1.74 (m, 14 H), 1.41-1.52 (m, 10 H), 1.02 (t, 12H).

MS (ES-) C₁₇H₂₇N₄O₈S. N(C₄H₉)₄ = 447.4 (M-1)、遊離のスルホン酸として。

【0022】

ステップ - 4 : (2S, 5R) - 硫酸モノ - { [(4 - アミノピペリジン - 4 - イル) カルボニル] - 7 - オキソ - 1, 6 - ジアザ - ビシクロ [3.2.1] オクタ - 6 - イル } エステル (I) の合成 :

電磁攪拌機を装着した 100 ml 丸底フラスコに、(2S, 5R) - tert - ブチル { (6 - スルホオキシ - 7 - オキソ - 1, 6 - ジアザ - ビシクロ [3.2.1] オクタ - 2 - イル - カルボニル) アミノ } ピペリジン - 1 - カルボキシレートのテトラブチルアンモニウム塩 (6.0 g) のジクロロメタン (15 ml) 中溶液を装入した。溶液を攪拌しながら -10 まで冷却し、これにトリフルオロ酢酸 (15 ml) を滴加した。反応混合物を -10 において 1 時間攪拌した。溶媒を 30 未満において真空下でその 1/3 容量まで蒸発させて、粘稠な残留物を得た。粘稠な残留物をジエチルエーテル (各回 60 ml) と共に 2 回攪拌して、沈殿物を得た。得られた固体を吸引濾過し、アセトン (90 ml) 中に懸濁させた。懸濁液に、2 - エチルヘキサン酸ナトリウムのアセトン中 10% 溶液を加えて、pH を 4.5 ~ 5.5 に調整した。懸濁液を 10 分間攪拌し、吸引濾過した。湿潤ケーキをアセトンで洗浄し、40 未満において真空下で乾燥させて、3 g の粗製化合物を得た。粗製化合物を、水性イソプロパノール (水 3 ml : イソプロパノール (isopropanol) 21 ml) と共に終夜攪拌して、さらに精製した。得られた懸濁液を吸引濾過し、水性イソプロパノール (水 1 ml : IPA 7 ml の混合物) で洗浄した。最後に、ケーキを 40 未満において真空下で乾燥させて、表題化合物を 1.8 g の量 (収率 65%) でオフホワイト色の固体として得た。

【0023】

分析

H¹NMR (DMSO-d₆, D₂O 交換) = 8.19 (d, D₂O と交換), 3.99 (s, 1H), 3.82-3.92 (m, 1H)

), 3.72 (d, 1H), 2.24 (br d, 3H), 2.90-3.04 (m, 5H), 1.96-2.06 (m, 1H), 1.80-1.94 (m, 3H), 1.58-1.72 (m, 4H).

MS (ES+) C₁₂H₂₀N₄O₆S = 349.2 (M+1)、遊離のスルホン酸として;

【 0 0 2 4 】

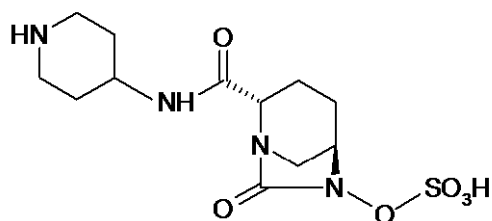
HPLCによる純度：99.2%

【 0 0 2 5 】

比旋光度：[]²⁵_D - 45.25°、(c 0.3%、水)

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔 1 〕 式 (I)

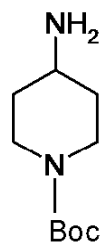


式 (I)

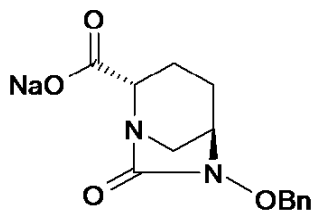
10

の化合物を調製するための方法であって、

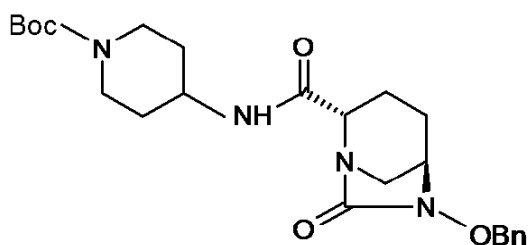
(a) 式 (I I) の化合物を式 (I I I) の化合物と反応させて、式 (I V) の化合物を得るステップと、



式 (II)



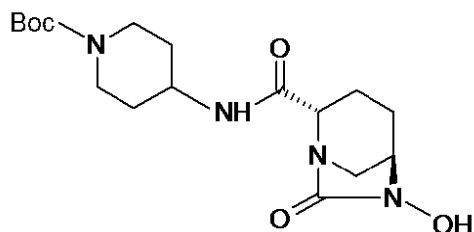
式 (III)



式 (IV)

30

(b) 式 (I V) の化合物を水素化分解して、式 (V)

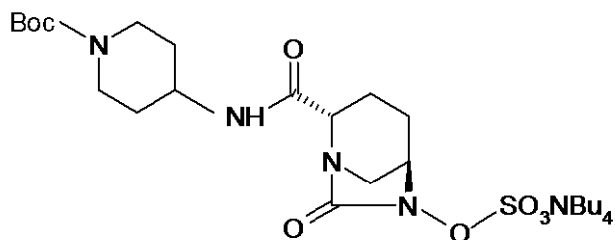


式 (V)

40

の化合物を得るステップと、

(c) 式 (V) の化合物をスルホン化して、式 (V I)



式 (VI)

10

の化合物を得るステップと、

(d) 式 (VI) の化合物を式 (I) の化合物に変換するステップとを含む、方法。

[2] 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドおよび1-ヒドロキシベンゾトリアゾールの存在下で式 (II) の化合物を式 (III) の化合物と反応させることによって、式 (IV) の化合物が得られる、前記 [1] に記載の方法。

[3] 反応が、溶媒としての水の存在下で行われる、前記 [2] に記載の方法。

[4] 式 (IV) の化合物を水素化分解して式 (V) の化合物を得るステップが、遷移金属触媒および水素源の存在下で行われる、前記 [1] に記載の方法。

[5] 遷移金属触媒がパラジウム担持炭素であり、水素源が水素ガスである、前記 [4] に記載の方法。

20

[6] 式 (V) の化合物をスルホン化して式 (VI) の化合物を得るステップが、式 (V) の化合物を三酸化イオウ-ピリジン錯体と反応させた後に水性テトラブチルアンモニウム硫酸水素塩で処理することによって行われる、前記 [1] に記載の方法。

[7] 式 (VI) の化合物をトリフルオロ酢酸と反応させることによって、式 (VI) の化合物が式 (I) の化合物に変換される、前記 [1] に記載の方法。

フロントページの続き

- (74)代理人 100093300
弁理士 浅井 賢治
- (74)代理人 100119013
弁理士 山崎 一夫
- (74)代理人 100123777
弁理士 市川 さつき
- (74)代理人 100193493
弁理士 藤原 健史
- (72)発明者 ワンキード カルナ スレシュ
インド アウランガバッド 431005 ガディア ヴィハール ロード カスリワル プーラ
ム イー タイプ ビルディング フラット ナンバービー8
- (72)発明者 スルワセ マヘシュ マニクラオ
インド マハラシュトラ 413607 ラトゥール ニランガ アット ポスト カザー シャ
ーズヒ スルワセ クリニック ドクター ヴィジャイクマー マニクラオ スルワセ気付
- (72)発明者 バブサー サティシュ
インド マハラシュトラ 431005 アウランガバッド シドコ セクター ビー エヌ-1
スミット レジデンスー フラット ナンバー101 プロット ナンバー225
- (72)発明者 デシュバンデ プラサッド ケシャブ
インド マハラシュトラ 431003 アウランガバッド アウラングプーラ サラスワティ
ブーヴァン コロニー ダブリュ ビー3
- (72)発明者 イエオール ラヴィンドラ ダッタトラヤ
インド マハラシュトラ 431003 アウランガバッド エヌ-2 シドコ プロット ナ
ンバー6 パル アpartment 13
- (72)発明者 パテル マヘッシュ ヴィタルプハイ
インド マハラシュトラ 431003 アウランガバッド エヌ-3 シドコ オボジット セ
ント メーラ スクール プロット ナンバー 157

審査官 谷尾 忍

- (56)参考文献 特表2011-510012(JP,A)
国際公開第2012/086241(WO,A1)
特表2016-511269(JP,A)
特表2016-510062(JP,A)
特表2016-514107(JP,A)
特表2016-515102(JP,A)
特表2014-521739(JP,A)
Eric VALEUR et al, Amide bond formation: beyond the myth of coupling reagents, CHEM. S
OC. REV., 2009年, vol.38, no.2, p.606-631

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C07D 471/08
CAplus/REGISTRY(STN)

- (54)【発明の名称】(2S, 5R) - 硫酸モノ - { [(4 - アミノピペリジン - 4 - イル)カルボニル] - 7 - オキ
ソ - 1, 6 - ジアザ - ピシクロ[3.2.1]オクタ - 6 - イル} エステルを調製するための方法