

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成25年4月25日 (2013.4.25)

【公表番号】特表2012-524119(P2012-524119A)

【公表日】平成24年10月11日 (2012.10.11)

【年通号数】公開・登録公報2012-041

【出願番号】特願2012-507282(P2012-507282)

【国際特許分類】

C 0 7 D 241/16 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 241/16

C 0 7 D 487/04 1 4 4

【手続補正書】

【提出日】平成25年3月6日 (2013.3.6)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

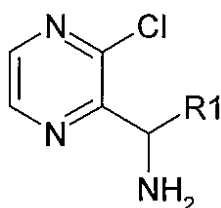
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

2,3-ジクロロピラジンを適切なジアリールイミンと反応すること、続く加水分解を含む、式 (I) の化合物またはその塩を製造するための方法：

【化 1】



I

式中、R1は、H、CN、カルボキシレートまたは任意に置換されたアリールもしくはヘテロアリールである。

【請求項 2】

R1がカルボキシレートである、請求項1に記載の方法。

【請求項 3】

R1が-C(O)OCH<sub>3</sub>または-C(O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>である、請求項1に記載の方法。

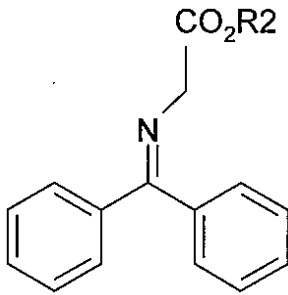
【請求項 4】

R1がHである、請求項1に記載の方法。

【請求項 5】

ジアリールイミンが下記：

## 【化 2】



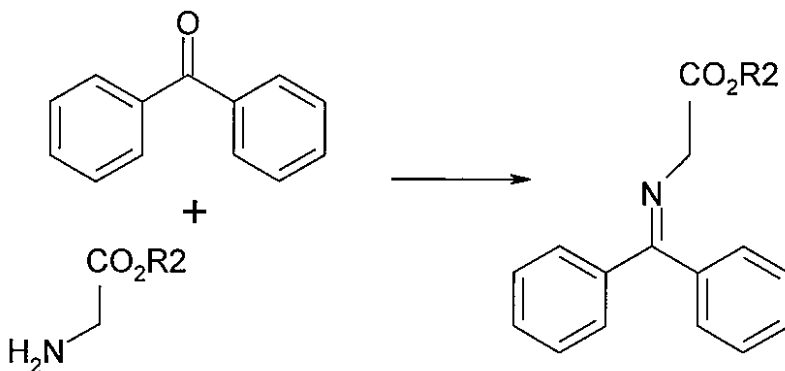
である、請求項2～4のいずれか一項に記載の方法であって、  
ここでR<sub>2</sub>がC<sub>1-10</sub>アルキルである、方法。

## 【請求項 6】

請求項5に記載の方法であって、ここで

(a) ジアリールイミンが反応：

## 【化 3】



によって製造され；

(b) (a) のジアリールイミン生成物および2,3-ジクロロピラジンを塩基の存在下において、共に反応させ；および

(c) (b)の生成物を加水分解させて、R<sub>1</sub>がHである式Iの化合物を得る、  
方法。

## 【請求項 7】

R<sub>2</sub>は、メチルである、請求項 6 に記載の方法。

## 【請求項 8】

少なくとも約0.5molの式Iの化合物が、少なくとも約50%の方法についての全体の収率において得られる、請求項6または7に記載の方法。

## 【請求項 9】

(a) は、トリエチルアミンまたはエチルジイソプロピルアミンの存在下において実施される、請求項6-8のいずれか1項に記載の方法。

## 【請求項 10】

(b) における塩基は、炭酸カリウムまたは炭酸セシウムを含む、請求項6-9のいずれか1項に記載の方法。

## 【請求項 11】

(b) は、約40～60 の温度にて実施される、請求項6-10のいずれか1項に記載の方法。

## 【請求項 12】

(c) は、水酸化カリウム、水酸化ナトリウムまたは水酸化リチウムの存在下において実施される、請求項6-11のいずれか1項の方法。

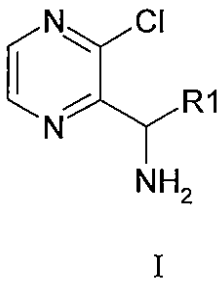
## 【請求項 13】

(c) は、塩酸、トリフルオロ酢酸、酢酸または硫酸の存在下において実施される、請求項6-12のいずれか1項の方法。

## 【請求項 14】

R1がカルボキシレートである、式I

【化4】



の化合物。

【請求項15】

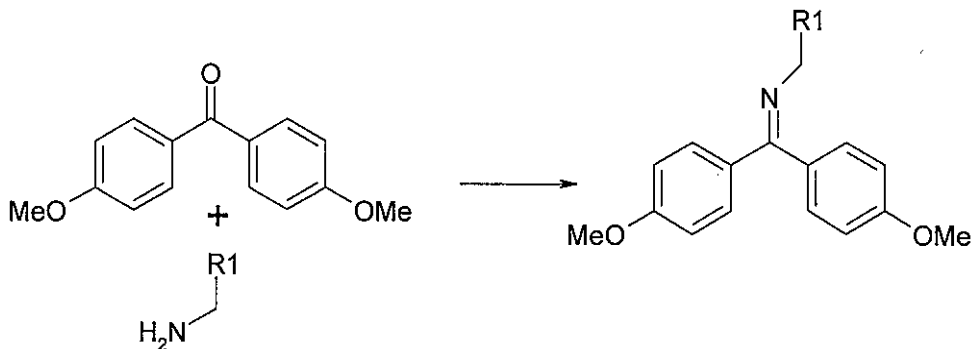
R1が $-C(O)OCH_3$ または $-C(O)OCH_2CH_3$ である、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

R1は、アリールまたはヘテロアリールであり、そのいずれかが、アリール、ヘテロアリール、 $C_1$ - $C_{10}$ アルキル、 $C_0$ - $C_{10}$ アルコキシ、ハロまたはシアノによって任意に置換され；

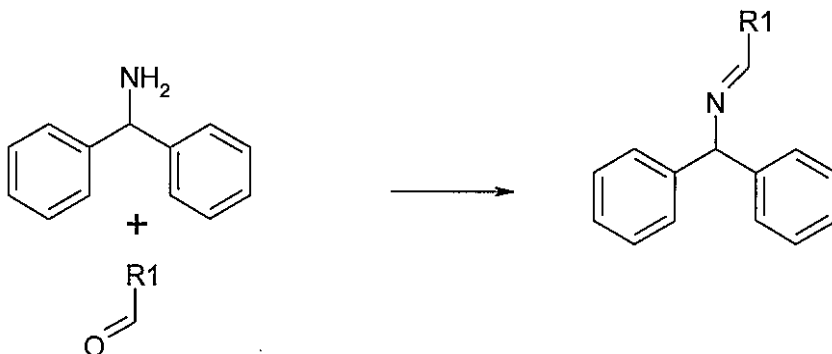
(a) ジアリールイミンは、反応1：

【化5】



によって、または反応2：

【化6】



によって製造され、

(b) (a)のジアリールイミン生成物および2,3-ジクロロピラジンを、塩基の存在下において、共に反応させ；および

(c) (b)の生成物を加水分解させて、式Iの化合物を得る、請求項1の方法。

【請求項17】

反応2を使用してジアリールイミンを製造する、請求項16に記載の方法。

【請求項18】

R1は、2-、3-または4-ピリジニル、ピラジニル、2-、4-もしくは5-ピリミジニル、ピリダジニル、トリアゾリル、テトラゾリル、イミダゾリル、2-もしくは3-チエニル、2-もしくは

は3-フリル、ピロリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、キノリル、イソキノリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾフラニルまたはベンゾチエニルから選択されるヘテロアリール基であり；およびヘテロアリール基は、 $C_1$ - $C_{10}$ アルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシまたはフェニルから選択される1つまたは複数の独立した置換基で任意に置換される、請求項1、16、または17に記載の方法。

【請求項 19】

R1は、2-フェニルキノリンである、請求項1、16、または17に記載の方法。

【請求項 20】

少なくとも約0.5molの式Iの化合物が、少なくとも約50%の方法についての全体の収率において得られる、請求項1または16-19に記載の方法。

【請求項 21】

反応1が、有機塩基およびルイス酸の存在下においてジアリールイミンを製造するために使用される、請求項16または18-20に記載の方法。

【請求項 22】

ルイス酸は、四塩化チタンを含む、請求項21に記載の方法。

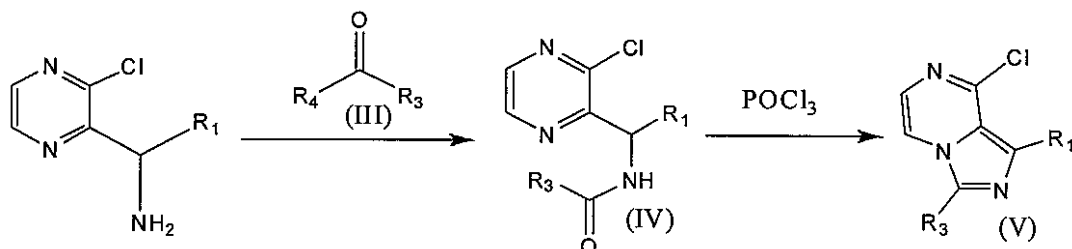
【請求項 23】

2,3-ジクロロピラジンとジアリールイミンの反応は、tert-ブトキシドまたは金属ヘキサメチルジシルアジドの存在下において実施される、請求項1または16-22に記載の方法。

【請求項 24】

反応：

【化 7】



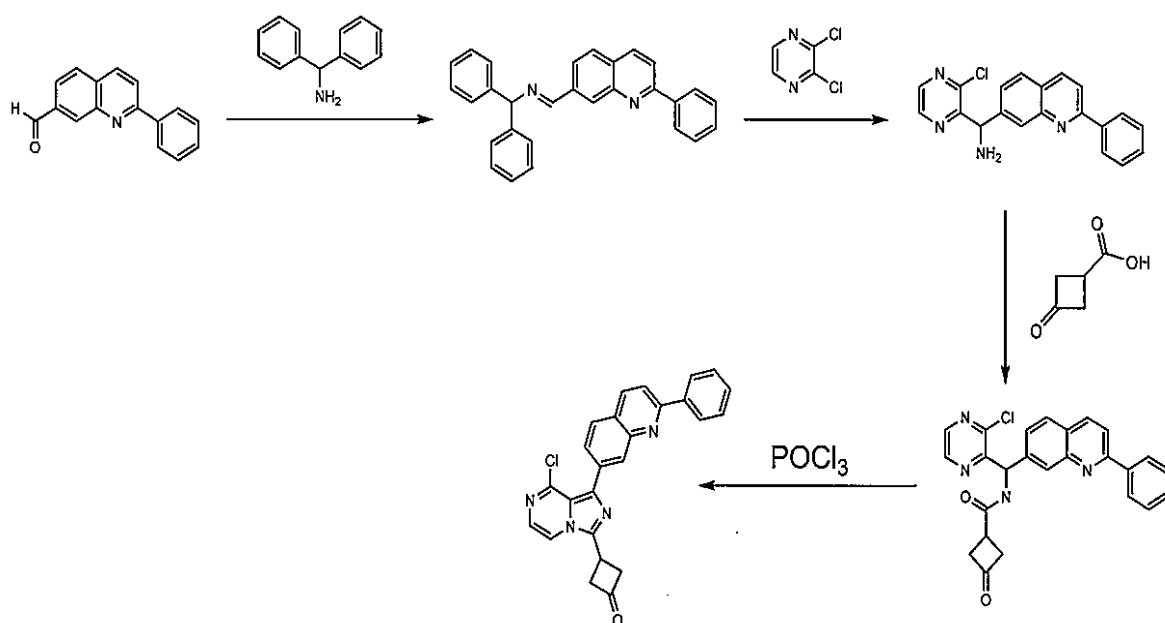
に従って式Iと化合物を反応することをさらに含み、

式中、 $R_3$ は、 $C_1$ - $C_{10}$ アルキル、 $C_3$ - $C_{12}$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれもがハロ、オキソ、シアノ、ヒドロキシおよび $C_1$ - $C_{10}$ アルキルから選択される1つまたは複数の独立した置換基によって任意に置換され；および $R_4$ は、ヒドロキシ、アルコキシ、クロロまたはイミダゾールである、請求項1-23のいずれか1項に記載の方法。

【請求項 25】

反応：

## 【化 8】



を含む、請求項1または16-24に記載の方法。