

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
25. Juni 2020 (25.06.2020)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2020/128020 A3

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 213/73 (2006.01) C07D 213/74 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2019/086760

(22) Internationales Anmeldedatum:
20. Dezember 2019 (20.12.2019)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
18215577.0 21. Dezember 2018 (21.12.2018) EP

(71) Anmelder: SALTIGO GMBH [DE/DE]; Kaiser-Wilhelm-Allee 40, 51369 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder: VAN DEM BRUCH, Karsten; Fahrstr. 1e, 51371 Leverkusen (DE).

(74) Anwalt: MATZKE, Michael; LANXESS Deutschland GmbH, LEX-IP Kennedyplatz 1, 50569 Köln (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): 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, JO, JP, KE, KG, KH, 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, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (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, 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).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eingehen (Regel 48 Absatz 2 Buchstabe h)

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts:

01. Oktober 2020 (01.10.2020)

(54) Title: PROCESS FOR PREPARING 2-ALKOXY-4-AMINO-5-METHYL-PYRIDINES AND/OR 2-ALKOXY-4-ALKYLAMINO-5-METHYL-PYRIDINES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 2-ALKOXY-4-AMINO-5-METHYL-PYRIDINEN UND/ODER VON 2-ALKOXY-4-ALKYLAMINO-5-METHYL-PYRIDINEN

(57) Abstract: The invention relates to a process for preparing 2-alkoxy-4-amino-5-methyl-pyridines of the formula (I) and/or 2-alkoxy-4-alkylamino-5-methyl-pyridines of the formula (II) from the corresponding 2-halogen-amino-pyridines and the corresponding alcohols in the presence of a base, and to the corresponding resulting compounds.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von 2-Alkoxy-4-amino-5-methyl-pyridinen der Formel (I) und/oder von 2-Alkoxy-4-alkylamino-5-methyl-pyridinen der Formel (II) aus den entsprechenden 2-Halogen-amino-pyridinen und den entsprechenden Alkoholen in Gegenwart von Base, sowie die daraus resultierenden Verbindungen.



WO 2020/128020 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP2019/086760

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER <i>C07D 213/73</i> (2006.01)i; <i>C07D 213/74</i> (2006.01)i		
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, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	US 9561228 B2 (CELGENE AVIOMICS RES INC [US]) 07 February 2017 (2017-02-07) examples 89,341,342,352,359	1-13
A	US 2013196993 A1 (BERGER MICHAEL [DE] ET AL) 01 August 2013 (2013-08-01) compounds A-606,A-607,A-617,A-618	1-13
Y	27 December 2013 (2013-12-27), abstract No. Database accession no. 72213525, Retrieved from: PubChem Compound [online] XP002790884 compound 72213525	1-13
Y	WO 2017012647 A1 (GALAPAGOS NV [BE]) 26 January 2017 (2017-01-26) page 122; example 3.69 ii	1-13
Y	SARAVANAN GOWRISANKAR ET AL. "A General and Efficient Catalyst for Palladium-Catalyzed C-O Coupling Reactions of Aryl Halides with Primary Alcohols" <i>JOURNAL OF THE AMERICAN CHEMICAL SOCIETY</i> , Vol. 132, No. 33, 25 August 2010 (2010-08-25), pages 11592-11598 DOI: 10.1021/ja103248d ISSN: 0002-7863, XP055583648 page 11596; table 2	1-13
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> 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 17 February 2020		Date of mailing of the international search report 10 August 2020
Name and mailing address of the ISA/EP European Patent Office p.b. 5818, Patentlaan 2, 2280 HV Rijswijk Netherlands Telephone No. (+31-70)340-2040 Facsimile No. (+31-70)340-3016		Authorized officer Grassi, Damian Telephone No.

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. claims: 1-13

Method according to claim 1.

2. claims: 14-16

Compounds of formulae (I) and (II) according to claim 14 (the group lacks unity of invention).

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: **1-13**

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/EP2019/086760

Patent document cited in search report			Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)			Publication date (day/month/year)
US	9561228	B2	07 February 2017	AU	2014214846	A1	23 July 2015
				CA	2900012	A1	14 August 2014
				CL	2015002194	A1	05 February 2016
				CN	105188371	A	23 December 2015
				CR	20150462	A	26 October 2015
				EA	201591051	A1	30 June 2016
				EP	2953457	A2	16 December 2015
				HK	1217410	A1	13 January 2017
				JP	2016509012	A	24 March 2016
				KR	20150119012	A	23 October 2015
				NI	201500099	A	12 October 2015
				PE	20151274	A1	12 September 2015
				PH	12015501660	A1	19 October 2015
				SG	11201505850W	A	28 August 2015
				TW	201446745	A	16 December 2014
				US	2014228322	A1	14 August 2014
				US	2016002176	A1	07 January 2016
				US	2016082008	A1	24 March 2016
				US	2017137406	A1	18 May 2017
				US	2017210729	A1	27 July 2017
WO	2014124230	A2	14 August 2014				
US	2013196993	A1	01 August 2013	AR	083200	A1	06 February 2013
				AU	2011310592	A1	14 March 2013
				BR	112013006030	A2	07 June 2016
				CA	2811369	A1	05 April 2012
				CN	103189356	A	03 July 2013
				CN	105294549	A	03 February 2016
				CO	6710926	A2	15 July 2013
				EP	2621903	A1	07 August 2013
				ES	2622881	T3	07 July 2017
				HU	E034042	T2	29 January 2018
				JP	5791725	B2	07 October 2015
				JP	2014500235	A	09 January 2014
				KR	20130139889	A	23 December 2013
				MX	340985	B	01 August 2016
				NZ	607580	A	30 January 2015
				PL	2621903	T3	31 August 2017
				RU	2013119681	A	10 November 2014
				US	2013196993	A1	01 August 2013
				WO	2012041873	A1	05 April 2012
				WO	2017012647	A1	26 January 2017

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES INV. C07D213/73 C07D213/74 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) 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, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	US 9 561 228 B2 (CELGENE AVIOMICS RES INC [US]) 7. Februar 2017 (2017-02-07) Beispiele 89,341,342,352,359 -----	1-13
A	US 2013/196993 A1 (BERGER MICHAEL [DE] ET AL) 1. August 2013 (2013-08-01) Verbindungen A-606,A-607,A-617,A-618 -----	1-13
Y	DATABASE PubChem Compound [Online] 27. Dezember 2013 (2013-12-27), XP002790884, Database accession no. 72213525 Verbindung 72213525 -----	1-13
Y	WO 2017/012647 A1 (GALAPAGOS NV [BE]) 26. Januar 2017 (2017-01-26) Seite 122; Beispiel 3.69 ii ----- -/--	1-13
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist "E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist "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) "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "Y" 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 "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
17. Februar 2020		10/08/2020
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Grassi, Damian

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	SARAVANAN GOWRISANKAR ET AL: "A General and Efficient Catalyst for Palladium-Catalyzed C-O Coupling Reactions of Aryl Halides with Primary Alcohols", JOURNAL OF THE AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, Bd. 132, Nr. 33, 25. August 2010 (2010-08-25), Seiten 11592-11598, XP055583648, ISSN: 0002-7863, DOI: 10.1021/ja103248d Seite 11596; Tabelle 2 -----	1-13

Feld Nr. II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein internationaler Recherchenbericht erstellt:

1. Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche diese Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich

2. Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, dass eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich

3. Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefasst sind.

Feld Nr. III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Diese Internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.

2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung solcher Gebühren aufgefordert.

3. Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.

4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Dieser internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfasst:
1-13

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Der Anmelder hat die zusätzlichen Recherchegebühren unter Widerspruch entrichtet und die gegebenenfalls erforderliche Widerspruchsgebühr gezahlt.
- Die zusätzlichen Recherchegebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt, jedoch wurde die entsprechende Widerspruchsgebühr nicht innerhalb der in der Aufforderung angegebenen Frist entrichtet.
- Die Zahlung der zusätzlichen Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-13

Verfahren gemäß Anspruch 1.

2. Ansprüche: 14-16

Verbindungen der Formeln (I) und (II) gemäß Anspruch 14 (die Gruppe ist nicht einheitlich).

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2019/086760

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	
US 9561228	B2	07-02-2017	AU 2014214846 A1	23-07-2015
			CA 2900012 A1	14-08-2014
			CL 2015002194 A1	05-02-2016
			CN 105188371 A	23-12-2015
			CR 20150462 A	26-10-2015
			EA 201591051 A1	30-06-2016
			EP 2953457 A2	16-12-2015
			HK 1217410 A1	13-01-2017
			JP 2016509012 A	24-03-2016
			KR 20150119012 A	23-10-2015
			NI 201500099 A	12-10-2015
			PE 20151274 A1	12-09-2015
			PH 12015501660 A1	19-10-2015
			SG 11201505850W A	28-08-2015
			TW 201446745 A	16-12-2014
			US 2014228322 A1	14-08-2014
			US 2016002176 A1	07-01-2016
			US 2016082008 A1	24-03-2016
			US 2017137406 A1	18-05-2017
			US 2017210729 A1	27-07-2017
WO 2014124230 A2	14-08-2014			
US 2013196993	A1	01-08-2013	AR 083200 A1	06-02-2013
			AU 2011310592 A1	14-03-2013
			BR 112013006030 A2	07-06-2016
			CA 2811369 A1	05-04-2012
			CN 103189356 A	03-07-2013
			CN 105294549 A	03-02-2016
			CO 6710926 A2	15-07-2013
			EP 2621903 A1	07-08-2013
			ES 2622881 T3	07-07-2017
			HU E034042 T2	29-01-2018
			JP 5791725 B2	07-10-2015
			JP 2014500235 A	09-01-2014
			KR 20130139889 A	23-12-2013
			MX 340985 B	01-08-2016
			NZ 607580 A	30-01-2015
			PL 2621903 T3	31-08-2017
			RU 2013119681 A	10-11-2014
US 2013196993 A1	01-08-2013			
WO 2012041873 A1	05-04-2012			
WO 2017012647	A1	26-01-2017	KEINE	