

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012142172/04, 28.03.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
06.04.2010 JP 2010-087915;
06.04.2010 JP 2010-087916;
07.05.2010 JP 2010-107195

(43) Дата публикации заявки: 20.05.2014 Бюл. № 14

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 06.11.2012(86) Заявка РСТ:
JP 2011/057521 (28.03.2011)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/125568 (13.10.2011)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

НИППОН СОДА КО., ЛТД. (JP)

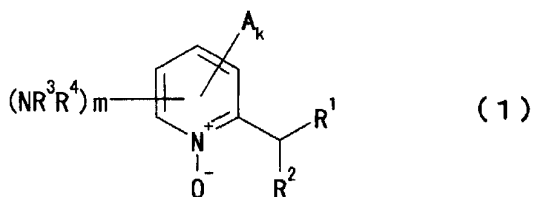
(72) Автор(ы):

КУТОСЕ Коити (JP),
ИНОУЕ Хироки (JP),
ЦИБОКУРА Сиро (JP)(54) **АЗОТСОДЕРЖАЩЕЕ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКОЕ СОЕДИНЕНИЕ И СПОСОБ ЕГО ПОЛУЧЕНИЯ**

(57) Формула изобретения

1. Замещенный аминопиридин-N-оксид, представленный формулой (1):

[Химическая формула 1]



в формуле (1) каждый из R^1 и R^2 независимо представляет собой атом водорода или незамещенную или замещенную алкильную группу; и R^1 и R^2 вместе могут образовывать цикл,

R^3 представляет собой атом водорода, незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу или незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу;

R^4 представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную

алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу;

А представляет собой гидроксильную группу, тиольную группу, аминогруппу, нитрогруппу, атом галогена или органическую группу;

m представляет собой любое из целых чисел от 1 до 4; и

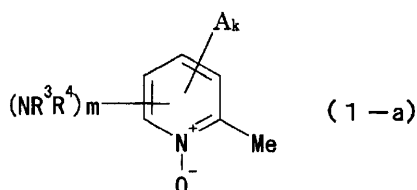
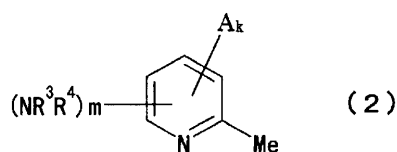
k представляет собой любое из целых чисел от 0 до 3,

в которой $k+m \leq 4$,

при условии, что 2-этоксикарбониламино-6-метилпиридин-N-оксид исключен.

2. Способ получения замещенного производного amino-6-метилпиридин-N-оксида, представленного формулой (1-a), включающий окисление замещенного производного amino-6-метилпиридина, представленного формулой (2), с применением пероксида в присутствии соли вольфрамофосфорной кислоты, представленной формулой (3):

[Химическая формула 2]



$Q_3[PW_4O_{24}]$ (3)

в которых

А представляет собой гидроксильную группу, тиольную группу, аминогруппу, нитрогруппу, атом галогена или органическую группу;

k представляет собой любое из целых чисел от 0 до 3;

R^3 представляет собой атом водорода, незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу или незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу;

R^4 представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу;

m представляет собой любое из целых чисел от 1 до 4;

в которых $k+m \leq 4$; и

Q представляет собой катион четвертичного азота.

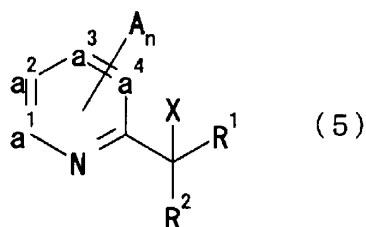
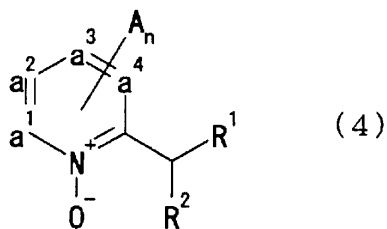
3. Способ получения замещенного производного amino-6-метилпиридин-N-оксида по п.2, в котором R^3 в формуле (2) и в формуле (1-a) представляет собой атом водорода.

4. Способ получения замещенного производного amino-6-метилпиридин-N-оксида по п.2, в котором катион четвертичного азота, который представлен Q в формуле (3), представляет собой катион четвертичного аммония.

5. Способ получения замещенного производного amino-6-метилпиридин-N-оксида по п.2, в котором соль вольфрамофосфорной кислоты, представленную формулой (3), получают без процедуры выделения после ее получения.

6. Способ получения соединения, представленного формулой (5), включающий взаимодействие соединения, представленного формулой (4), с галогенирующим агентом:

[Химическая формула 3]



в которых каждый из a^1 - a^4 независимо представляет собой атом углерода, атом азота, атом кислорода или атом серы;

каждый из R^1 и R^2 независимо представляет собой атом водорода или незамещенную или замещенную алкильную группу; и R^1 и R^2 вместе могут образовывать цикл;

A представляет собой гидроксильную группу, тиольную группу, аминогруппу, нитрогруппу, атом галогена или органическую группу;

n представляет собой любое из целых чисел от 0 до 4; и

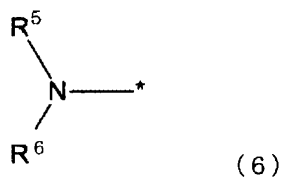
несколько групп A может связываться с образованием цикла, когда n равно 2 или более; и

X представляет собой атом галогена.

7. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.6, в котором все a^1 - a^4 в формуле (4) и формуле (5) представляют собой атомы углерода.

8. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.6, в котором по меньшей мере один из заместителей A в формуле (4) и формуле (5) представляет собой группу, представленную формулой (6):

[Химическая формула 4]



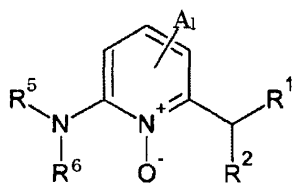
в формуле (6) * указывает место связывания;

R^5 представляет собой атом водорода, незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу;

R^6 представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу; и R^5 и R^6 могут связываться с образованием цикла.

9. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.6, в котором соединение, представленное формулой (4), представляет собой соединение, представленное формулой (7), и соединение, представленное формулой (5), представляет собой соединение, представленное формулой (8):

[Химическая формула 5]



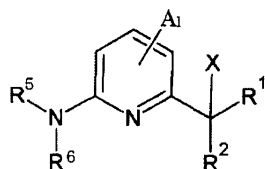
(7)

в формуле (7) A, R¹ и R² имеют те же значения, которые указаны выше;
l представляет собой любое из целых чисел от 0 до 3;

R⁵ представляет собой атом водорода, незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу;

R⁶ представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу; и R⁵ и R⁶ могут связываться с образованием цикла.

[Химическая формула 6]



(8)

в формуле (8) A, l, R¹, R², X, R⁵ и R⁶ имеют те же значения, которые указаны выше.

10. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.8, в котором R⁵ представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу или незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу.

11. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.6, в котором галогенирующий агент представляет собой по меньшей мере один агент, выбранный из группы, состоящей из тионилхлорида, тионилбромид и сульфурилхлорида.

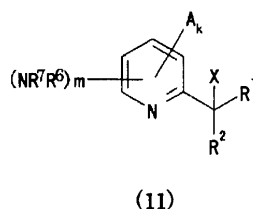
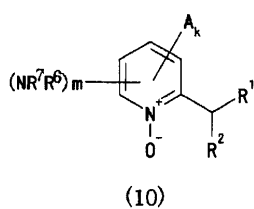
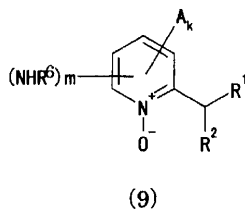
12. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.6, в котором реакцию осуществляют в присутствии источника галоген-ионов, который растворим в органическом растворителе.

13. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.6, в котором галогенирующий агент представляет собой по меньшей мере один агент, выбранный из группы, состоящей из фосгена, дифосгена, трифосгена и оксихлорида фосфора.

14. Способ получения соединения, представленного формулой (11), включающий стадию превращения соединения, представленного формулой (9), в соединение, представленное формулой (10); и

стадию взаимодействия соединения, представленного формулой (10), с галогенирующим агентом для превращения в соединение, представленное формулой (11):

[Химическая формула 7]



в которых каждый из R^1 и R^2 независимо представляет собой атом водорода или незамещенную или замещенную алкильную группу; и R^1 и R^2 вместе могут образовывать цикл;

R^6 представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу;

R^7 представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу;

A представляет собой гидроксильную группу, тиольную группу, аминогруппу, нитрогруппу, атом галогена или органическую группу;

X представляет собой атом галогена;

m представляет собой любое из целых чисел от 1 до 4; и

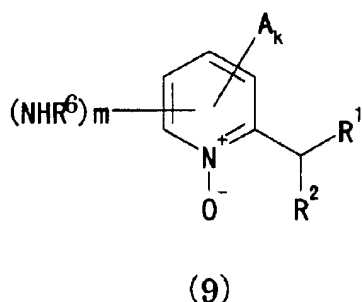
k представляет собой любое из целых чисел от 0 до 3;

в которых $k+m \leq 4$.

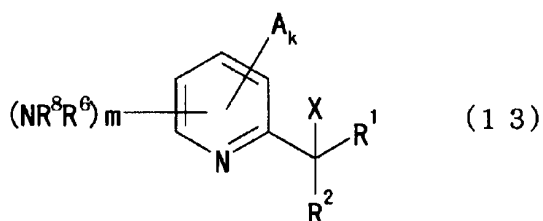
15. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.14, в котором стадию синтеза соединения, представленного формулой (11), осуществляют в присутствии источника галоген-ионов, который растворим в органическом растворителе.

16. Способ получения соединения, представленного формулой (13), включающий взаимодействие соединения, представленного формулой (9), с галогенирующим агентом в присутствии соединения, представленного формулой (12).

[Химическая формула 8]



[Химическая формула 9]



R^8X^1 (12)

в которых каждый из R^1 и R^2 независимо представляет собой атом водорода или незамещенную или замещенную алкильную группу; и R^1 и R^2 вместе могут образовывать цикл;

R^6 представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную гетероарилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу, незамещенную или замещенную алкилсульфонильную группу или незамещенную или замещенную арилсульфонильную группу;

R^8 представляет собой незамещенную или замещенную алкилкарбонильную группу, незамещенную или замещенную арилкарбонильную группу или незамещенную или замещенную алкоксикарбонильную группу;

A представляет собой гидроксильную группу, тиольную группу, аминогруппу, нитрогруппу, атом галогена или органическую группу;

m представляет собой любое из целых чисел от 1 до 4;

k представляет собой любое из целых чисел от 0 до 3;

в которых $k+m \leq 4$;

X представляет собой атом галогена; и

X^1 представляет собой атом хлора или атом брома.

17. Способ получения азотсодержащего гетероциклического соединения по п.16, в котором реакцию осуществляют в присутствии источника галоген-ионов, который растворим в органическом растворителе.

18. Способ получения по п.12, 15 или 17, в котором источник галоген-ионов, который растворим в органическом растворителе, представляет собой галогенированную соль аммония или галогенированную соль фосфония.

19. Способ получения по п.12, 15 или 17, в котором источник галоген-ионов, который растворим в органическом растворителе, представляет собой галогенидную соль третичного или четвертичного алкиламмония, содержащую C_2 -алкильную группу или алкильную группу с большим числом атомов углерода, или галогенидную соль алкилфосфония, содержащую C_2 -алкильную группу или алкильную группу с большим числом атомов углерода.

20. Способ получения по любому из пп.14-17, в котором галогенирующий агент представляет собой по меньшей мере один агент, выбранный из группы, состоящей из тионилхлорида, тионилбромиды, оксихлорида фосфора, сульфурилхлорида, фосгена, дифосгена и трифосгена.

21. Способ получения по п.18, в котором галогенирующий агент представляет собой по меньшей мере один агент, выбранный из группы, состоящей из тионилхлорида, тионилбромиды, оксихлорида фосфора, сульфурилхлорида, фосгена, дифосгена и трифосгена.

21. Способ получения по п.19, в котором галогенирующий агент представляет собой по меньшей мере один агент, выбранный из группы, состоящей из тионилхлорида, тионилбромиды, оксихлорида фосфора, сульфурилхлорида, фосгена, дифосгена и трифосгена.