



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012149012/04, 19.11.2012

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
15.07.2003 GB 0316546.1

(66) Номер(а) и дата(ы) подачи ранее поданной(ых) заявки(ок): **2009134310 15.09.2009**

(43) Дата публикации заявки: 27.05.2014 Бюл. № 15

Адрес для переписки:

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

(71) Заявитель(и):

НОВАРТИС АГ (СН)

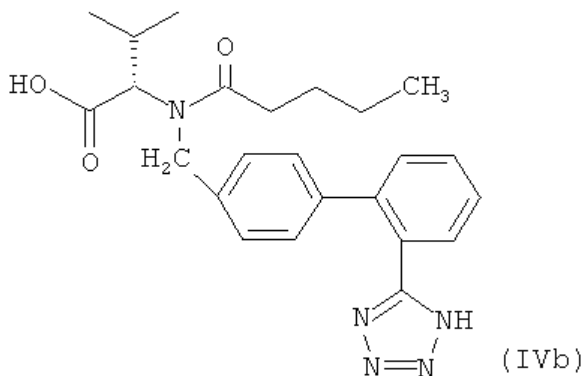
(72) Автор(ы):

Готфрид ЗЕДЕЛЬМАЙЕР (DE)

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ПРОИЗВОДНЫХ ТЕТРАЗОЛА ИЗ БОРОРГАНИЧЕСКИХ И АЛЮМИНИЙОРГАНИЧЕСКИХ АЗИДОВ

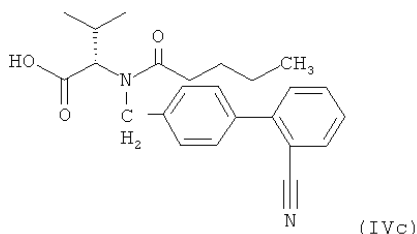
(57) Формула изобретения

1. Способ получения соединения формулы (IVb)



или его таутомера или соли;

включающий реакцию сложного эфира соединения формулы (IVc)



где сложным эфиром соединения формулы (IVc) является, сложный эфир, полученный из алифатического или арилатифатического спирта, где

- алифатический остаток представляет собой C_1 - C_{20} -алкил, C_2 - C_{20} -алкенил или

C₂-C₂₀-алкинил, в каждый из которых может быть включен NH, O, S или NH, который замещен C₁-C₈-алкилом, фенил-C₁-C₈-алкилом, C₂-C₈-алкил-C₂-C₁₀алканоилом, фенил-C₂-C₅-алканоилом, бензоилом, C₁-C₈-алкансульфонилом или бензолсульфонилом; и
- арилалифатический остаток представляет собой C₁-C₈-алкил, C₂-C₈-алкенил или C₂-C₈-алкинил, каждый, из которых замещен фенилом или нафтилом;

с соединением формулы (R₁)(R₂)M-N₃ (IIb), в которой R₁ и R₂ независимо друг от друга обозначают органический остаток, и M обозначает алюминий или бор;

и

выделение полученного соединения формулы (IVb).

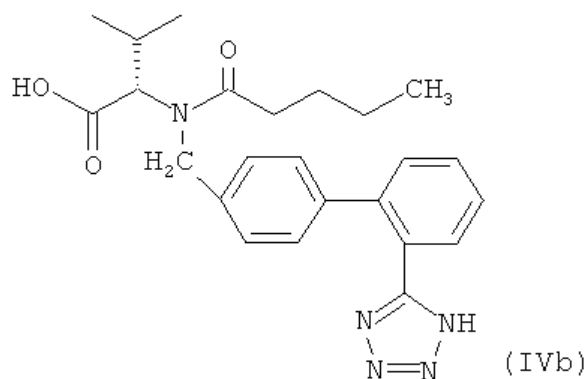
2. Способ по п.1, в котором сложным эфиром соединения формулы (IVc) является, сложный эфир, полученный из алифатического или арилалифатического спирта, где
- алифатический остаток представляет собой метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил, трет-бутил, 2-пропенил, 2-бутенил, 3-бутенил или пропаргил, в каждый из которых может быть включен NH, O, S или NH, который замещен C₁-C₈-алкилом, фенил-C₁-C₈-алкилом, C₂-C₈-алкил-C₂-C₁₀алканоилом, фенил-C₂-C₅-алканоилом, бензоилом, C₁-C₈-алкансульфонилом или бензолсульфонилом; и

- арилалифатический остаток представляет собой бензил, 2-фенэтил или 2-фенилэтенил.

3. Способ по п.1, в котором сложным эфиром соединения формулы (IVc) является, сложный эфир, полученный из алифатического или арилалифатического спирта, где
- алифатический остаток представляет собой метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил, трет-бутил, 2-пропенил, 2-бутенил, 3-бутенил или пропаргил; и
арилалифатический остаток представляет собой бензил, 2-фенэтил или 2-фенилэтенил.

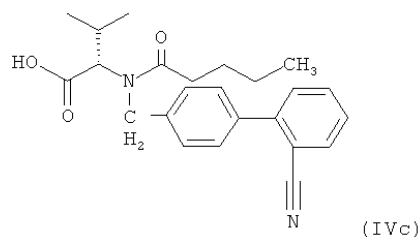
4. Способ по п.1, в котором сложный эфир соединения формулы (IVc) представляет собой его C₁-C₇-алкиловый сложный эфир или его бензиловый сложный эфир.

5. Способ по п.1, получения соединения формулы (IVb)



или его таутомера или соли;

включающий реакцию бензинового сложного эфира соединения формулы (IVc)



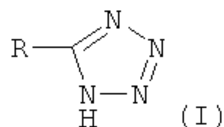
с азидом формулы (R₁)(R₂)M-N₃ (IIb), в которой R₁ и R₂ независимо друг от друга обозначают органический остаток, и M обозначает алюминий или бор; и выделение полученного соединения формулы (IVb).

6. Способ по одному из пп.1-5, в котором используется соединение формулы $(R_1)(R_2)M-N_3$ (IIb), в которой М обозначает алюминий или бор; и R_1 и R_2 независимо друг от друга обозначают C_1 - C_8 -алкил, такой как метил, этил, пропил, диизобутил, трет-бутил или н-октил; C_3 - C_7 -алкенил, такой как аллил или кротил; C_3 - C_7 -циклоалкил, такой как циклогексил; фенил- C_1 - C_4 -алкил, такой как бензил или 2-фенэтил; фенил- C_3 - C_5 -алкенил, такой как циннамил, или C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_8 -алкил, такой как циклопропилметил или циклогексилметил.

7. Способ по одному из пп.1-5, в котором используется соединение формулы $(R_1)(R_2)M-N_3$ (IIb), в которой М обозначает алюминий или бор; и R_1 и R_2 независимо друг от друга обозначают C_1 - C_8 -алкил, C_3 - C_8 -циклоалкил, C_3 - C_8 -циклоалкил- C_1 - C_8 -алкил или арил- C_1 - C_8 -алкил.

8. Способ по одному из пп.1-5, в котором соединение формулы (IIb) выбирается из группы состоящей из азида диметилалюминия, азида диэтилалюминия, азида диизопропилалюминия, азида дипропилалюминия, азида диизобутилалюминия, азида дибутилалюминия, азида дициклогексилалюминия, азида диэтилбора, азида диизопропилбора, азида дипропилбора, азида диизобутилбора, азида дибутилбора, азида дициклогексилбора и азида дифенилбора.

9. Применение соединения формулы $(R_1)(R_2)M-N_3$ (IIb), в которой М обозначает алюминий или бор; и R_1 и R_2 независимо друг от друга обозначают C_1 - C_8 -алкил, такой как метил, этил, пропил, диизобутил, трет-бутил или н-октил; C_3 - C_7 -алкенил, такой как аллил или кротил; C_3 - C_7 -циклоалкил, такой как циклогексил; фенил- C_1 - C_4 -алкил, такой как бензил или 2-фенэтил; фенил- C_3 - C_5 -алкенил, такой как циннамил, или C_3 - C_8 -пиклоалкил- C_1 - C_8 -алкил, такой как циклопропилметил или циклогексилметил, в способе получения тетразола формулы



или его таутомера или соли, в которой R обозначает органический остаток.