

【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22年5月27日(2010.5.27)

【公表番号】特表2009-532428(P2009-532428A)

【公表日】平成21年9月10日(2009.9.10)

【年通号数】公開・登録公報2009-036

【出願番号】特願2009-503555(P2009-503555)

【国際特許分類】

C 07 D 401/04 (2006.01)

C 07 D 413/04 (2006.01)

C 07 D 417/04 (2006.01)

C 07 D 403/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04

C 07 D 413/04

C 07 D 417/04

C 07 D 403/04

【手続補正書】

【提出日】平成22年3月29日(2010.3.29)

【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

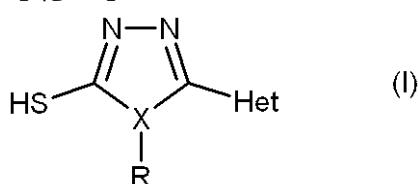
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



[式中

Xは、窒素であり；

Hetは、アリールまたはヘテロアリールを意味し；その各々は、ハロゲン、C₁ - C₆アルキル、C₁ - C₆アルコキシ、ハロC₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニル、C₂ - C₆アルキニル、ハロC₁ - C₆アルコキシ、-C(O)R₁、ニトロ、ヒドロキシ、-NR₂R₃、シアノもしくはZ基から選択される1個～4個のJ基によって置換されていてもよく；

R₁は、C₁ - C₄アルキル、-OR₃または-NR₃R₄であり；

R₂は、水素またはC₁ - C₆アルキルであり；

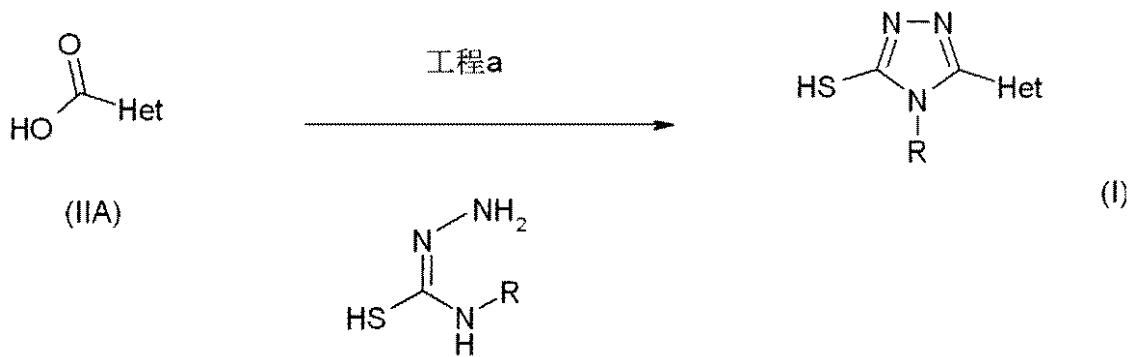
R₃は、水素またはC₁ - C₆アルキルであり；

Rは、H、C₁ - C₆アルキル、アリール、ベンジルであり；その各々は、1個～4個のJ基により置換されていてもよい】

で示されるトリアゾール誘導体の製造方法であって、以下のスキーム1：

スキーム1

【化 2】



[ここで、

工程 a は、式 (I) で示される化合物を得るための、化合物 (IIA) の塩基性条件下での 3 - チオセミカルバジド誘導体との反応、次に無機塩基および n - プロパンホスホン酸環状無水物を用いた処理、そして最後に無機酸を用いた pH 調節を意味する] に従う方法

【請求項 2】

式(I)のトリアゾール誘導体にて、置換Hetが4-メチル-1,3-オキサゾール-5-イルであり、R₁がメチルである、請求項1記載の方法。

【請求項3】

式(Ⅰ)のトリアゾール誘導体にて、置換H_{et}が2,4-ジメチル-1,3-チアゾール-5-イルであり、R₁がメチルである、請求項1記載の方法。

【請求項4】

式(Ⅰ)のトリアゾール誘導体にて、置換H e tが2-メチル-3-ピリジニルであり、R₁がメチルである、請求項1記載の方法。

【請求項 5】

式(Ⅰ)のトリアゾール誘導体にて、非置換Hetzが4-ピリダジニルであり、R₁がメチルである、請求項1記載の方法。

【請求項6】

式(Ⅰ)のトリアゾール誘導体にて、置換H e tが2,4-ジメチル-1,3-オキサゾール-5-イルであり、R₁がメチルである、請求項1記載の方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 0 2

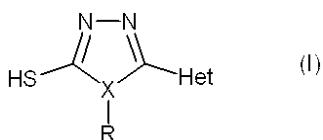
【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 0 2 】

本発明は、式(Ⅰ)：

【化 1】



〔式中〕

Xは、窒素であり；

He t は、アリールまたはヘテロアリールを意味し；その各々は、ハロゲン、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ アルコキシ、ハロC₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニル、C₂ - C₆ アルキニル、ハロC₁ - C₆ アルコキシ、-C(O)R₁、ニトロ、ヒドロキシ、-NR₂、R₃、シアノもしくはZ基から選択される1個～4個のJ基によって置換され

ていてもよい；

R₁は、C₁ - C₄アルキル、-OR₃または-NR₃R₄であり；

R₂は、水素またはC₁ - C₆アルキルであり；

R₃は、水素またはC₁ - C₆アルキルであり；

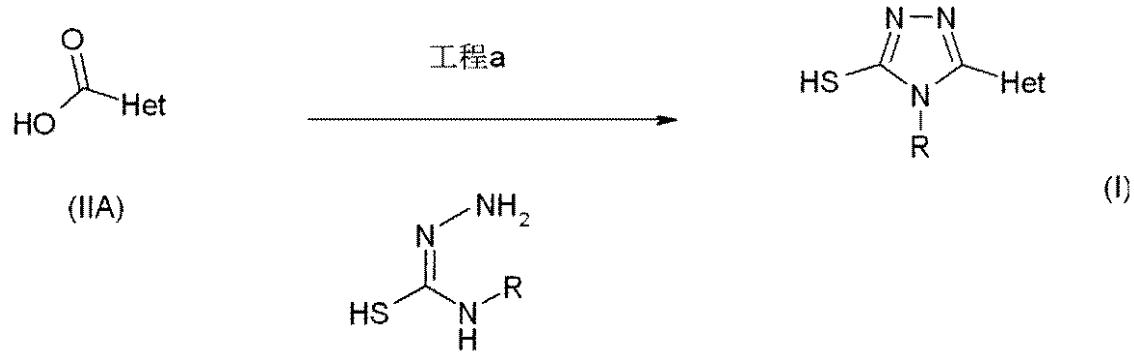
Rは、H、C₁ - C₆アルキル、アリール、ベンジルであり；その各々は、1個～4個のJ基により置換されていてもよい】

で示されるトリアゾール誘導体を製造するための新規な方法であって、以下のスキーム1

：

スキーム1

【化2】



[ここで、

工程aは、式(I)で示される化合物を得るための、化合物(IIA)の塩基性条件下での3-チオセミカルバジド誘導体との反応、次に無機塩基およびn-プロパンホスホン酸環状無水物(propane phosphonic cyclic anhydride)を用いた処理、そして最後に無機酸を用いたpH調節を意味する]

に従う方法に関する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

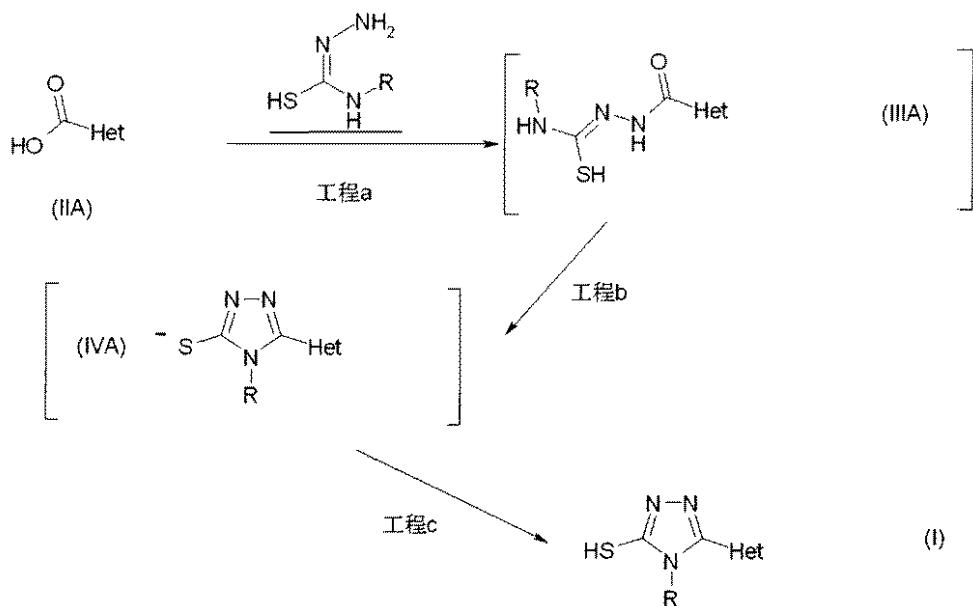
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

本発明の工程は、より詳細には、次のように記載することができる：

【化5】



一般的に商業的に入手可能であるか、または文献にある既知の方法に従って調製され得る、出発物質である複素環式カルボン酸は、1当量を適當な溶媒（例えば、ジメチルホルムアミド；酢酸エチル；アセトニトリルおよびテトラヒドロフラン、そして他の極性の非プロトン性溶媒）に好都合に溶解させることができ、そして、わずかに過剰量（1.10当量）の3-チオセミカルバジド誘導体、例えば4-メチル誘導体で処理し得る。次いで、有機塩基（例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、また場合により他の脂肪族の芳香族アミン）を室温（RT）で加える。

次いで、N-プロパンホスホン酸環状無水物（酢酸エチル中50%w/w）を0度～40度の温度範囲で滴加し得る。次いで、この添加により約0になる場合もあるので、温度を20分～60分にわたって15未満に維持する。次いで、得られた混合物を20で2時間～16時間攪拌した。