

【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 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 413/04

C 0 7 D 417/04

C 0 7 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

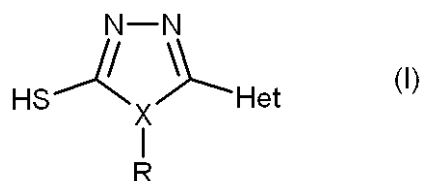
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) :

【化 1】



[ 式中

X は、窒素であり；

H e 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、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、ハロ C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、ハロ C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、- C ( O ) R<sub>1</sub>、ニトロ、ヒドロキシ、- N R<sub>2</sub> R<sub>3</sub>、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；

R<sub>1</sub> は、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、- O R<sub>3</sub> または - N R<sub>3</sub> R<sub>4</sub> であり；

R<sub>2</sub> は、水素または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり；

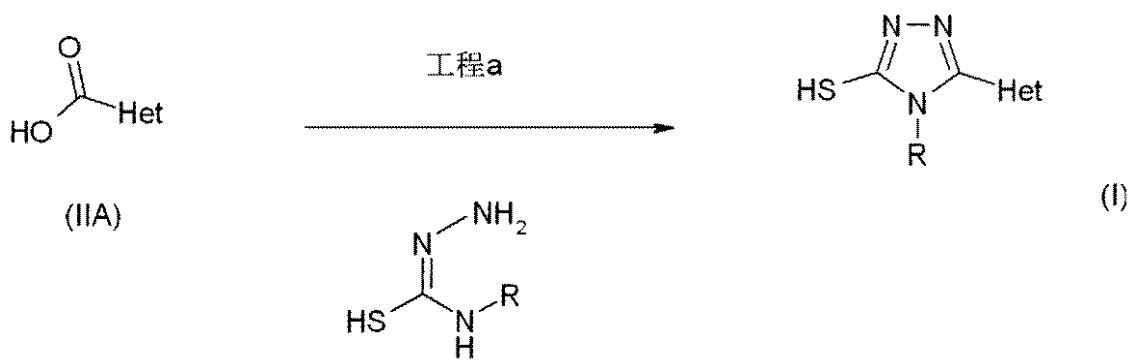
R<sub>3</sub> は、水素または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり；

R は、H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 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 ( I I A ) 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 H e t が 4 - メチル - 1 , 3 - オキサゾール - 5 - イルであり、R<sub>1</sub> 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 e t が 2 , 4 - ジメチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イルであり、R<sub>1</sub> 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、R<sub>1</sub> 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 H e t が 4 - ピリダジニルであり、R<sub>1</sub> 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、R<sub>1</sub> 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】0002

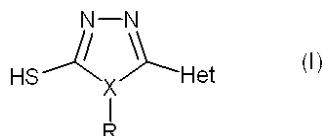
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0002】

本発明は、式 ( I ) :

## 【化 1】



[ 式中

X は、窒素であり；

H e 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、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、ハロ C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、ハロ C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、- C ( O ) R<sub>1</sub>、ニトロ、ヒドロキシ、- N R<sub>2</sub> R<sub>3</sub>、シアノもしくは Z 基から選択される 1 個 ~ 4 個の「基」によって置換され

ていてもよく；

$R_1$  は、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $-OR_3$  または  $-NR_3R_4$  であり；

$R_2$  は、水素または  $C_1 - C_6$  アルキルであり；

$R_3$  は、水素または  $C_1 - C_6$  アルキルであり；

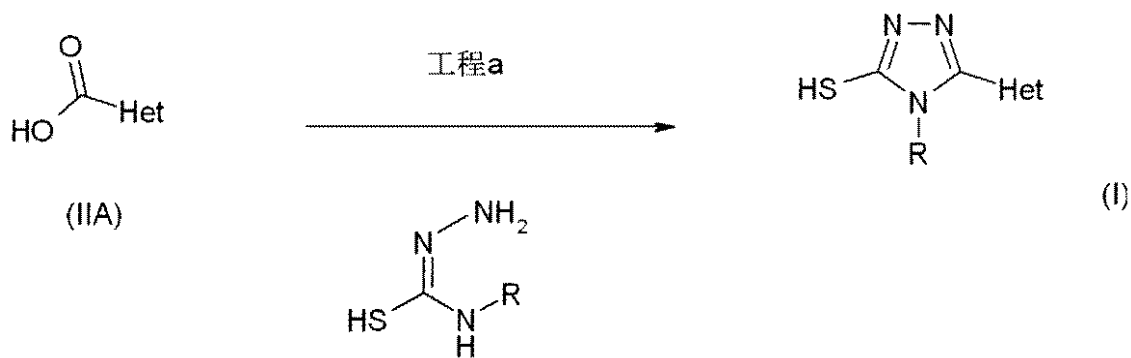
$R$  は、 $H$ 、 $C_1 - C_6$  アルキル、アリール、ベンジルであり；その各々は、1個～4個の「基」により置換されていてもよい]

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

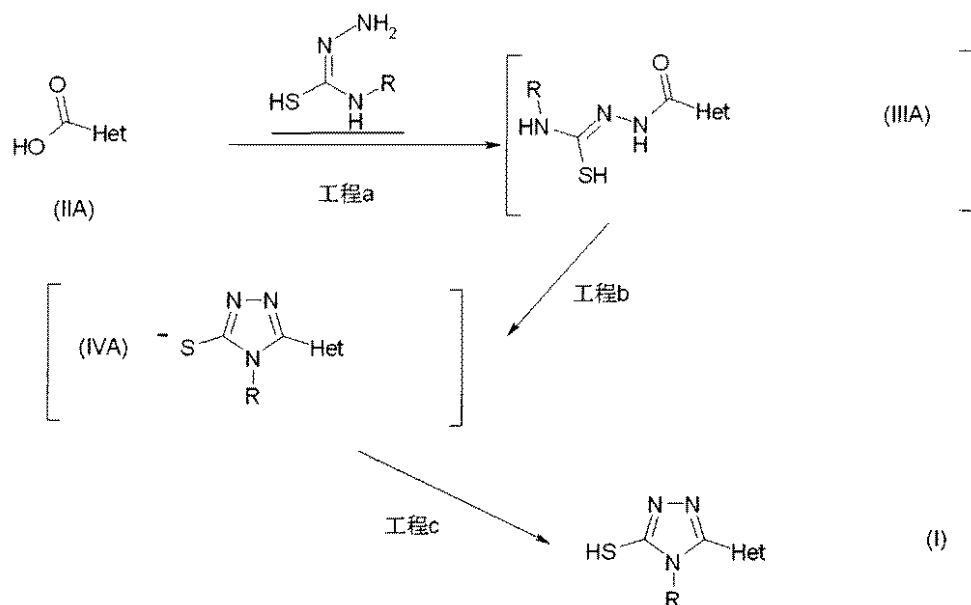
【補正方法】変更

【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当量を適当な溶媒（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。