



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2010102135/04, 16.06.2008

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
27.06.2007 EP 07012546.3

(43) Дата публикации заявки: 10.08.2011 Бюл. № 22

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 27.01.2010(86) Заявка РСТ:
EP 2008/004830 (16.06.2008)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2009/000442 (31.12.2008)

Адрес для переписки:

101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", пат.пов.
И.А.Веселицкой, рег.№ 0011

(71) Заявитель(и):

ЗИНГЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ (CH),
ЗИНГЕНТА ЛИМИТЕД (GB)

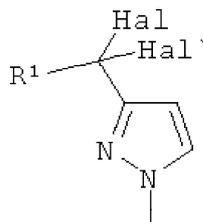
(72) Автор(ы):

БОУДЕН Мартин Чарлз (GB),
ГОТТ Брайан Дейвид (GB),
ДЖЕКСОН Дейвид Антони (CH)

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ПИРАЗОЛОВ

(57) Формула изобретения

1. Способ получения соединения формулы (I)



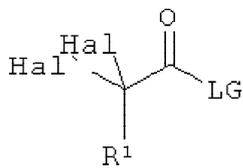
(I)

в которой Hal и Hal' независимо обозначают Cl, или F, и R¹ обозначает H, Cl или F,
включающий стадии

i) взаимодействия соединения формулы (II)

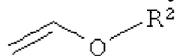
RU 2010102135 A

RU 2010102135 A

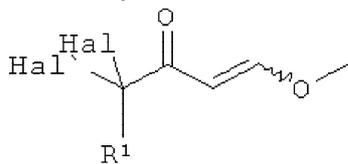


(II)

в которой Hal, Hal' и R¹ являются такими, как определено выше, и LG обозначает отщепляющуюся группу с простым эфиром енола формулы (III)



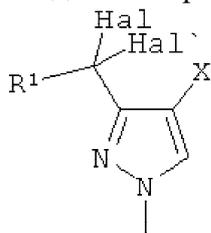
с получением соединения формулы (IV)



(IV)

в которой Hal, Hal' и R¹ являются такими, как определено выше, и
ii) взаимодействия соединения формулы (IV) с метилгидразином с получением пиразола формулы (I).

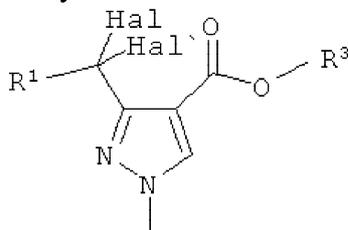
2. Способ по п.1, включающий дополнительную стадию галогенирования соединения формулы (I) с получением 4-галогенпиразола формулы (V)



(V)

в которой Hal, Hal' и R¹ являются такими, как определено по п.1, и X обозначает Cl, Br или I.

3. Способ по п.2, включающий дополнительную стадию взаимодействия соединения формулы (V) с монооксидом углерода в присутствии воды или C₁-C₆-спирта с получением соединения формулы (VI)



(VI)

в которой Hal, Hal' и R¹ являются такими, как определено по п.1, и R³ выбран из группы, включающей H и C₁-C₆-алкил.

4. Способ по п.3, в котором реакцию проводят в присутствии палладиевого катализатора.

5. Способ по п.3, включающий дополнительную стадию гидролиза соединения формулы (VI), в которой R³ обозначает C₁-C₆-алкил, с образованием соединения формулы (VI), в которой R³ обозначает H, или его соли.

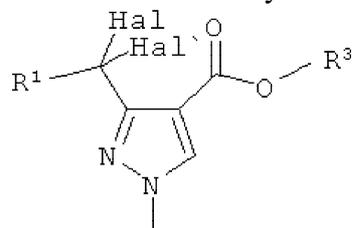
6. Способ по п.1, в котором Hal и Hal' обозначают F, и R¹ обозначает H.

7. Способ по п.1, в котором Hal и Hal' обозначают Cl, и R¹ обозначает H.

8. Способ по п.7, включающий стадию обмена галогена для превращения Hal и Hal', представляющих собой Cl, в F.

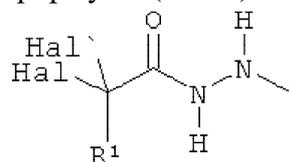
9. Способ по п.1, в котором Hal, Hal' и R¹ обозначают F.

10. Способ получения соединения формулы (VI)



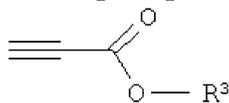
(VI)

в которой Hal, Hal' и R¹ являются такими, как определено по п.1, и R³ выбран из группы, включающей H и C₁-C₆-алкил, включающий реакцию гидрида формулы (XXIII)



(XXIII)

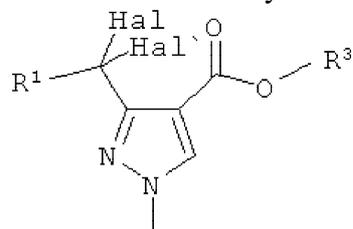
в которой Hal, Hal' и R¹ являются такими, как определено выше, с алкилпропаргилатом формулы (XXIV)



(XXIV)

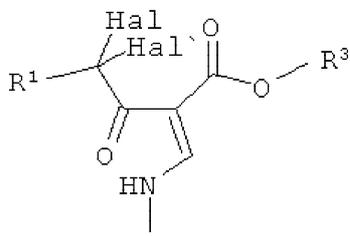
в которой R³ является таким, как определено выше.

11. Способ получения соединения формулы (VI)



(VI)

в которой Hal, Hal' и R¹ являются такими, как определено по п.1, и R³ выбран из группы, включающей H и C₁-C₆-алкил, включающий взаимодействие соединения формулы (XXV)



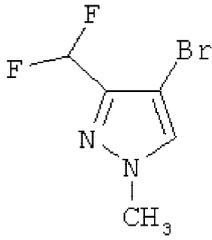
(XXV)

в которой Hal, Hal', R¹ и R³ являются такими, как определено выше, с хлорамином.

12. Способ по п.10, включающий дополнительную стадию гидролиза соединения формулы (VI), в которой R³ обозначает C₁-C₆-алкил, с образованием соединения формулы (VI), в которой R³ обозначает H, или его соли.

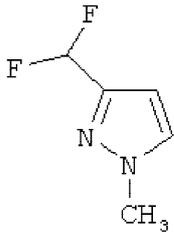
13. Способ по п.10, в котором Hal и Hal' обозначают F, и R¹ обозначает H.

14. Соединение формулы X



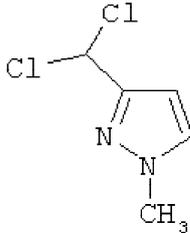
(X)

15. Соединение формулы VIII



(VIII)

16. Соединение формулы VII



(VII)