(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
14. November 2013 (14.11.2013)

WIPO | PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2013/167552 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 403/14 (2006.01) *C07D 249/04* (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2013/059418

(22) Internationales Anmeldedatum:
6. Mai 2013 (06.05.2013)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
12167152.3 8. Mai 2012 (08.05.2012) EP

(71) Anmelder: **BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE]; Müllerstr. 178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder: **MILITZER, Hans-Christian**; Waldweg 2, 51519 Odenthal (DE). **EGGERT, Johannes**; Johann-Sebastian-Bach-Str. 64, 61250 Usingen (DE).

(74) Anwalt: **BIP PATENTS**; c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Creative Campus Monheim, Alfred-Nobel-Str. 10, 40789 Monheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

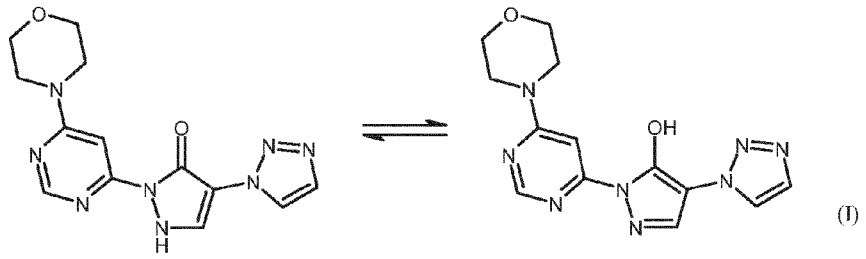
— *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)*

Veröffentlicht:

— *mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)*

(54) **Title**: METHOD FOR THE PREPARATION OF TRIAZOLE COMPOUNDS

(54) **Bezeichnung** : VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON TRIAZOL-VERBINDUNGEN



(I)

AA Keto-Form BB Enol-Form

AA Keto form
BB Enol form

(57) **Abstract**: The present invention relates to a method for the preparation of 1-[6-(morpholino-4-yl)-pyrimidino-4-yl]-4-(1H-1,2,3-triazolo-1-yl)-1H-pyrazolo-5-ol (I - enol form) or 2-[6-(morpholino-4-yl)-pyrimidino-4-yl]-4-(1H-1,2,3-triazolo-1-yl)-1,2-dihydro-3H-pyrazolo-3-one (I - keto form) and sodium-1-[6-(morpholino-4-yl)-pyrimidino-4-yl]-4-(1H-1,2,3-triazolo-1-yl)-1H-pyrazolo-5-olate (II) starting from 1, 2,3-triazole (III), methylbromoacetate (IV-Me-Br) or ethylbromoacetate (IV-Et-Br), 4,6-dichloropyrimidine (VIII), morpholine (IX) and hydrazine (XII).

(57) **Zusammenfassung**: Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von 1-[6-(Morpholin-4-yl)pyrimidin-4-yl]-4-(1H-1,2,3-triazol-1-yl)-1H-pyrazol-5-ol (I - Enol-Form) bzw. 2-[6-(Morpholin-4-yl)pyrimidin-4-yl]-4-(1H-1,2,3-triazol-1-yl)-1,2-dihydro-3H-pyrazol-3-on (I - Keto-Form) und Natrium-1-[6-(morpholin-4-yl)pyrimidin-4-yl]-4-(1H-1,2,3-triazol-1-yl)-1H-pyrazol-5-olat (II) ausgehend von1,2,3-Triazol (III), Bromessigsäuremethylester (IV-Me-Br) oder Bromessigsäureethylester (IV-Et-Br), 4,6-Dichlorpyrimidin (VIII), Morpholin (IX) und Hydrazin (XII).

WO 2013/167552 A1