

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2004-527511(P2004-527511A)

【公表日】平成16年9月9日(2004.9.9)

【年通号数】公開・登録公報2004-035

【出願番号】特願2002-573759(P2002-573759)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4166 (2006.01)
A 6 1 K 31/4178 (2006.01)
A 6 1 K 31/421 (2006.01)
A 6 1 K 31/422 (2006.01)
A 6 1 K 31/426 (2006.01)
A 6 1 K 31/427 (2006.01)
A 6 1 K 31/438 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/454 (2006.01)
A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 P 1/02 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 19/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/08 (2006.01)
A 6 1 P 19/10 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 27/16 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/04 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 233/76 (2006.01)
C 0 7 D 233/78 (2006.01)
C 0 7 D 401/06 (2006.01)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)
C 0 7 D 401/14 (2006.01)
C 0 7 D 403/04 (2006.01)
C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)
C 0 7 D 403/14 (2006.01)
C 0 7 D 405/10 (2006.01)
C 0 7 D 405/12 (2006.01)
C 0 7 D 405/14 (2006.01)
C 0 7 D 409/06 (2006.01)
C 0 7 D 409/12 (2006.01)
C 0 7 D 409/14 (2006.01)
C 0 7 D 413/06 (2006.01)
C 0 7 D 417/10 (2006.01)
C 0 7 D 417/14 (2006.01)
C 0 7 D 471/10 (2006.01)
C 0 7 D 277/20 (2006.01)
C 0 7 D 277/34 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/4166
A 6 1 K 31/4178
A 6 1 K 31/421
A 6 1 K 31/422
A 6 1 K 31/426
A 6 1 K 31/427
A 6 1 K 31/438
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/454
A 6 1 K 31/4545
A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/506
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 P 1/02
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/10 1 0 1
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 19/06
A 6 1 P 19/08
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 27/16
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 29/00 1 0 1
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 35/04
A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 233/76
 C 0 7 D 233/78
 C 0 7 D 401/06
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 403/04
 C 0 7 D 403/06
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 403/14
 C 0 7 D 405/10
 C 0 7 D 405/12
 C 0 7 D 405/14
 C 0 7 D 409/06
 C 0 7 D 409/12
 C 0 7 D 409/14
 C 0 7 D 413/06
 C 0 7 D 417/10
 C 0 7 D 417/14
 C 0 7 D 471/10 1 0 3
 C 0 7 D 277/34

【手続補正書】

【提出日】平成17年2月1日(2005.2.1)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0294

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0294】

出発物質を、以下のように製造した。

R - (2,5 - ジオキソ - 4 - イミダゾリジニル)メタンスルホニル 塩化物

25 mlのAcOHと2 mlの水の混合液中の、R - 5 - ([(2,5 - ジオキソ - 4 - イミダゾリジニル)メチル]ジスルファニル)メチル) - 2,4 - イミダゾリジンジオン(6.9 mol)の懸濁液に、強く攪拌しながら、氷浴上に置いたガス注入用チューブとサーモメーターと短い還流管を付けた三口フラスコ中で、塩素ガスを15分間(全ての沈殿物が溶解するまで)、最高温度+5 でパブルした。次に、それをさらに15分間攪拌し、少量になるまで真空下で蒸留し(最高温度30)、50 mlのジクロロメタンに溶解し、飽和NaHCO₃(約25 ml)で、次に10% チオ硫酸ナトリウムで、注意深く振盪し、乾燥し、蒸留し、THF - ヘキサンから結晶化した(Lora-Tamayo, M. et al, 1968, An. Quim., 64(6):591-606)。

¹H - NMR (DMSO - d₆): 3.21m (1.1H), 3.3m (0.7H), 4.65m (1H).

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0416

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0416】

1 - (1,1' - ビフェニル - 4 - イルスルホニル)プロパン - 2 - オン

1 - (1,1' - ビフェニル - 4 - イルチオ)プロパン - 2 - オン(6.9 mg, 0.28 mmol)

を、炭酸水素ナトリウム(72 mg, 0.85 mmol)と、オキソソ(525 mg, 0.85 mmol)と、水(5 ml)と、メタノール(10 ml)と共に、室温で3時間攪拌した。水(50 ml)を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した(3 × 25 ml)。抽出物を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、蒸留し、78 mg(99%)の生成物を得た。さらなる精製なしで、用いるのに十分な純度であった。

LC-MS (APCI) m/z 275 (MH⁺);

¹H-NMR (CDCl₃): 2.47 (3H, s); 4.22 (2H, s); 7.44-7.54 (3H, m); 7.64 (2H, d); 7.80, 7.97 (4H, abq, J=8.6 Hz).

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

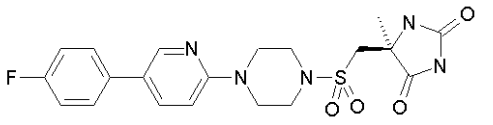
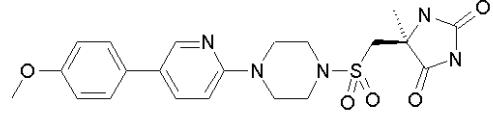
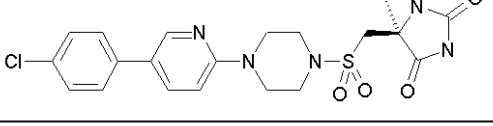
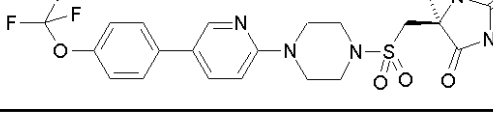
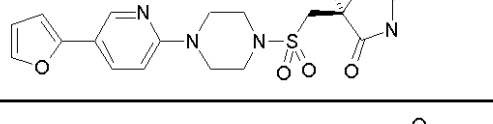
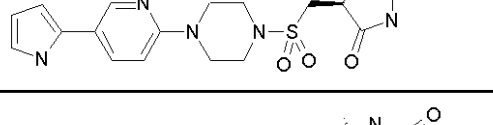
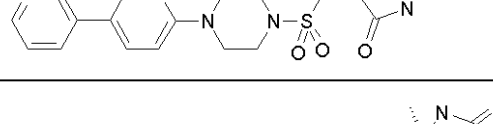
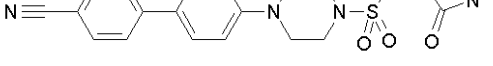
【補正対象項目名】0493

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0493】

【表34】

ヒダントイン	分析 ⁽¹⁾
	m/z 448 (MH ⁺)
	m/z 460 (MH ⁺)
	m/z 464, 466 (MH ⁺)
	m/z 514 (MH ⁺)
	m/z 420 (MH ⁺)
	m/z 419 (MH ⁺)
	m/z 431 (MH ⁺)
	m/z 455 (MH ⁺)

(1): NMRデータは、実験部参照。