

【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21年2月5日(2009.2.5)

【公表番号】特表2008-523130(P2008-523130A)

【公表日】平成20年7月3日(2008.7.3)

【年通号数】公開・登録公報2008-026

【出願番号】特願2007-545917(P2007-545917)

【国際特許分類】

C 0 7 D	207/34	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
C 0 7 D	405/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/4025	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/16	(2006.01)
A 6 1 P	33/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/14	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)
A 6 1 P	37/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/04	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
C 0 7 D	401/04	(2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	207/34	C S P
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/40	
C 0 7 D	405/04	
A 6 1 K	31/4025	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/08	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	11/16	
A 6 1 P	33/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	9/14	
A 6 1 P	17/04	
A 6 1 P	37/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	7/04	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
C 0 7 D	401/04	
A 6 1 K	31/4439	

【 手続補正書 】

【 提出日 】 平成20年12月9日 (2008.12.9)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0063

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0063】

b) 氷冷した攪拌している t -BuOK (0.673 g、6 mmol) の THF (20 mL) 溶液に、不活性雰囲気下、20 - 30 分にわたり 3 - (3, 5 - ジクロロ - フェニル) - アクリロニトリル (0.99 g、5 mmol) および TosMIC (1.17 g、6 mmol) の組み合わせの THF (10 mL) 溶液を滴下する。1 時間後、氷浴の添加を除き、および反応混合物を室温で一晩攪拌する。溶媒を減圧下除去し、残留固体を EtOAc および水に分配する。水性相を EtOAc で抽出し、有機相を合わせ、水、塩水で洗浄し、 $MgSO_4$ で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去して、褐色固体を得る。粗生成物をフラッシュクロマトグラフィー (イソヘキサンから 1 : 1 イソヘキサン : EtOAc の勾配) で精製して、4 - (3, 5 - ジクロロ - フェニル) - 1H - ピロール - 3 - カルボニトリルを得る ; $[M - H]^-$ 235 / 237。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0067

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0067】

実施例 28

[3 - シアノ - 4 - (3 - メタンスルホニル - フェニル) - ピロール - 1 - イル] - 酢酸の製造

a) 氷冷した攪拌している 1 M BH_3 の THF (25 mL、25 mmol) 溶液に、不活性雰囲気下、10 分にわたり 3 - メタンスルホニル安息香酸 (2 g、10 mmol) の THF (20 mL) 溶液を滴下する。反応混合物を室温で一晩攪拌し、次いで 0 °C に冷却して、その後水 (2 mL) を添加する。溶媒を減圧下除去し、残渣を DCM および NaOH に分配する。有機層を単離し、 $MgSO_4$ で乾燥させ、濾過する。溶媒を減圧下で除去して、(3 - メタンスルホニル - フェニル) - メタノールを得る ; $[M - H]^-$ 185。