

【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2月9日(2006.2.9)

【公表番号】特表2005-516936(P2005-516936A)

【公表日】平成17年6月9日(2005.6.9)

【年通号数】公開・登録公報2005-022

【出願番号】特願2003-552754(P2003-552754)

【国際特許分類】

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 409/12 C S P

A 6 1 K 31/497

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 0 5

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 413/14

【手続補正書】

【提出日】平成17年12月15日(2005.12.15)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 9】

式(1)の特定の化合物は立体異性体で存在し得る。本発明は式(1)の化合物の全ての幾何異性体および光学異性体、ならびにラセミ体を含むその混合物を包含するものと理解される。互変異性体およびその混合物も本発明の一態様をなす。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 3 0

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 0】

R⁵がクレームに定義されているような任意に置換されていてもよいアリールまたはヘテロアリール環である構造(II)または(1)の化合物は、式(XI)または(VII)(ここで、LGは臭素、塩素またはヨウ素のような好適な脱離基である)の化合物を取得し、それを、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]パラジウム(II)クロリドのようなパラジウム触媒、フッ化セシウム、酢酸ナトリウムまたは炭酸セシウムのような好適な塩基、およびメタノールまたはエタノールのような好適な溶媒中で、フェニルボロン酸のようなアリールまたはヘテロアリールボロン酸と反応させ、40~80℃に加熱することにより製造することができる。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0095

【補正方法】変更

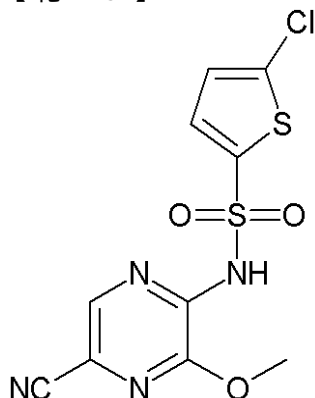
【補正の内容】

【0095】

実施例 31

5-クロロ-N-[5-シアノ-3-メトキシ-2-ピラジニル]-2-チオフェンスルホンアミド

【化 49】



乾燥N,N-ジメチルホルムアミド(5mL)(10分間溶液に窒素を通すことで脱酸素化したもの)中、実施例 1からの生成物(0.1g)、シアン化亜鉛(0.02g)およびテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)(0.015g)を窒素下、80℃で9時間加熱した後、反応混合物を減圧下で蒸発乾固させた。酢酸エチル/イソヘキサン 1/1で溶出するシリカでのクロマトグラフィーにより、標題化合物を得た(0.05g)。

m/e 329 ($M-1^+$),

^1H NMR (DMSO) 8.41 (2H, s), 7.70 (1H, d), 7.25 (1H, d), 3.93 (3H, s).

MP 218-219℃.