

(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
2. Dezember 2004 (02.12.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/103976 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 233/50**,
265/08, 235/30, 409/12, 495/04, 413/12, 277/18, 265/18

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/004955

(22) Internationales Anmeldedatum:
10. Mai 2004 (10.05.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 23 701.1 22. Mai 2003 (22.05.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **AVENTIS PHARMA DEUTSCHLAND
GMBH** [DE/DE]; Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt
(DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **HEINELT, Uwe**
[DE/DE]; Mosbacher Strasse 54, 65187 Wiesbaden (DE).
LANG, Hans-Jochen [DE/DE]; Rüdesheimer Strasse 7,
65719 Hofheim (DE).

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

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT,
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

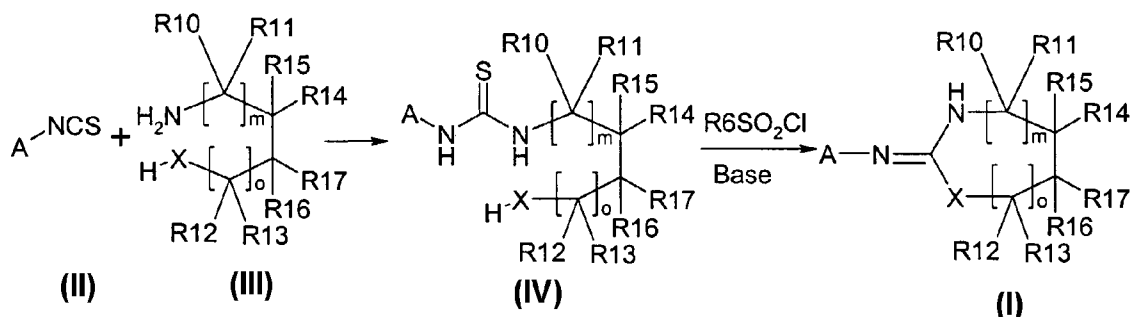
Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu ver-
öffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR SYNTHESISING HETEROCYCLIC COMPOUNDS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR SYNTHESE HETEROCYCLISCHER VERBINDUNGEN



(57) Abstract: The invention relates to a method illustrated in model 1 for synthesising heterocyclic compounds of formula (I). According to said method, isothiocyanate of formula (II) is reacted with the primary amine of formula (III) to obtain thiourea of formula (IV). The thiourea of formula (IV) is then converted into the heterocycle of formula (I) using a base and a sulfonic acid.

(57) Zusammenfassung: Gegenstand der Erfindung ist das in Schema 1 dargestellte Verfahren zur Synthese von heterocyclischen Verbindungen der Formel (I). Dabei wird zunächst das Isothiocyanat der Formel (II) mit dem primären Amin der Formel (III) zum Thioharnstoff der Formel (IV) umgesetzt. Anschliessend wird der Thioharnstoff der Formel (IV) mit einer Base und einem Sulfon-säurechlorid in den Heterocyclus der Formel (I) überführt.

WO 2004/103976 A2