

【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 10 月 12 日 (2006.10.12)

【公表番号】特表 2006-517202 (P2006-517202A)

【公表日】平成 18 年 7 月 20 日 (2006.7.20)

【年通号数】公開・登録公報 2006-028

【出願番号】特願 2006-500307 (P2006-500307)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 221/22 (2006.01)**

C 0 7 C 229/50 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 221/22

C 0 7 C 229/50

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 8 月 23 日 (2006.8.23)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

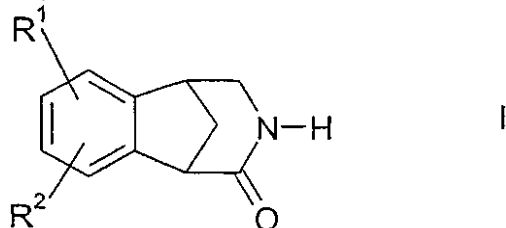
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

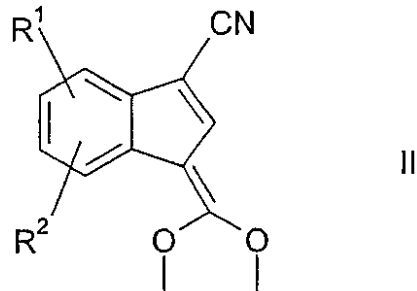
式 I

【化 1】



の化合物を製造するための方法であって、水素化触媒および酸の存在において、式 I I

【化 2】



の化合物を水素ガスおよび式 R<sup>3</sup>OH を有するアルコールで水素化することを含む前記方法：

〔式中、

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ、トリフルオロメチル、ハロゲン、スルホニルアルキル、アルキルアミノ、アミド、エステル、アリアル

アルキル、ヘテロアルキルおよびアリール アルコキシから独立して選択されるか；

または  $R^1$  および  $R^2$  はそれらが結合する炭素原子と一緒に単環または二環を形成し；  
そして  $R^3$  は  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；そして

a. 水素化触媒は約 5 % ~ 約 10 % のパラジウム 炭素からなり；

b. 水素化触媒は触媒対式 I I の化合物の重量比が約 1 : 99 ~ 約 10 : 90 の範囲で存在し；

c. 水素化触媒は水の重量で約 30 % ~ 約 60 % からなり；

d. ニトリル基は対応するアミノ基に還元され；そして

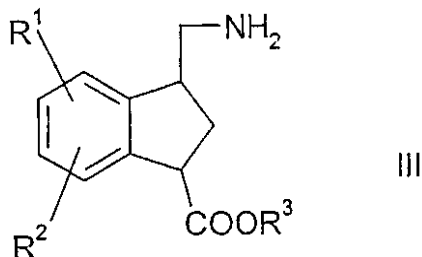
e. 酸は酸対アミノ基の等価比、約 1 : 1 で存在する ]。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の方法であって、

a. 式 I I の化合物の水素化が式

【化 3】



(式中  $R^3$  は  $C_1 \sim C_8$  アルキルである) の中間体化合物の形成を引き起こし；そして

b. 式 I I I の中間体化合物が式  $R^3 OH$  (式中  $R^3$  は  $C_1 \sim C_8$  アルキルである) のアルコールを含む溶媒中で、塩基による処理により式 I の化合物に変換される、前記方法。

【請求項 3】

式 I I I の中間体化合物が前もって単離されずに式 I に変換される、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

$R^3$  が  $C_3 \sim C_8$  であり、そしてアミノ基が酸塩として結合する式 I I I の中間体化合物が、式 I の化合物への変換の前に単離される、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 5】

前記水素化触媒が炭上約 5 % パラジウムからなる、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

触媒対式 I I の化合物の前記重量比が約 10 : 90 である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 7】

前記水素化触媒が水の約 50 重量 % である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 8】

前記酸が硫酸である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 9】

前記塩基が族 I 金属アルコキシドである、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 10】

前記塩基が *tert*-ブトキシドナトリウムである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 11】

式 I の化合物が以下のものからなる群から選択される、請求項 1 に記載の方法：

10 - アザ - トリシクロ [ 6 . 3 . 1 . 0 . 2 . 7 ] ドデカ - 2 , 4 , 6 - トリエン - 9 - オン；

3 - トリフルオロメチル - 10 - アザ - トリシクロ [ 6 . 3 . 1 . 0 . 2 , 7 ] ドデカ - 2 ( 7 ) , 3 , 5 - トリエン - 9 - オン；

( + ) - 3 - トリフルオロメチル - 10 - アザ - トリシクロ [ 6 . 3 . 1 . 0 . 2 , 7 ] ドデカ - 2 ( 7 ) , 3 , 5 - トリエン - 9 - オン；

( - ) - 3 - トリフルオロメチル - 10 - アザ - トリシクロ [ 6 . 3 . 1 . 0 . <sup>2</sup> , <sup>7</sup> ]  
ドデカ - 2 ( 7 ) , 3 , 5 - トリエン - 9 - オン ;  
3 - フルオロ - 10 - アザ - トリシクロ [ 6 . 3 . 1 . 0 . <sup>2</sup> , <sup>7</sup> ] ドデカ - 2 ( 7 ) ,  
3 , 5 - トリエン - 9 - オン ;  
( + ) - 3 - フルオロ - 10 - アザ - トリシクロ [ 6 . 3 . 1 . 0 . <sup>2</sup> , <sup>7</sup> ] ドデカ - 2  
( 7 ) , 3 , 5 - トリエン - 9 - オン ; および  
( - ) - 3 - フルオロ - 10 - アザ - トリシクロ [ 6 . 3 . 1 . 0 . <sup>2</sup> , <sup>7</sup> ] ドデカ - 2  
( 7 ) , 3 , 5 - トリエン - 9 - オン。