

【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 07 D 221/22 (2006.01)

C 07 C 229/50 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 221/22

C 07 C 229/50

C 07 B 61/00 300

【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

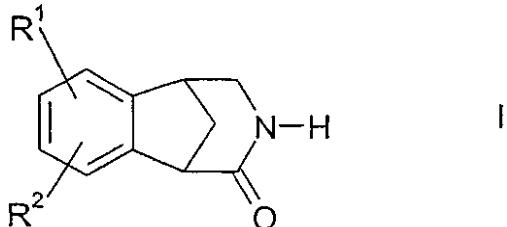
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

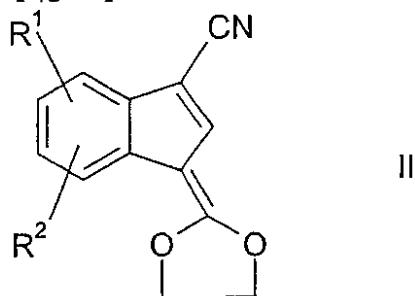
式I

【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II

【化2】



の化合物を水素ガスおよび式R³OH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、

R¹およびR²は水素、C₁～C₅アルキル、C₁～C₅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、アリール

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 : 9 9 ~ 約 1 0 : 9 0 の範囲で存在し；

c . 水素化触媒は水の重量で約 3 0 % ~ 約 6 0 % 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

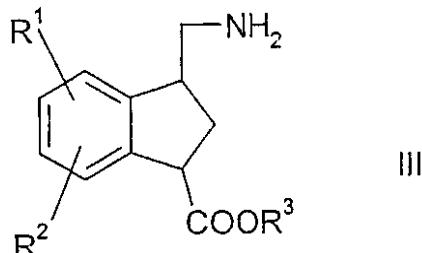
e . 酸は酸対アミノ基の等価比、約 1 : 1 で存在する]。

#### 【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 1 0 : 9 0 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 5 0 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 - プ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：

1 0 - 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 - 1 0 - 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 - 1 0 - 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 - 1 0 - 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 - 1 0 - 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 - 1 0 - 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 - 1 0 - 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。