

公告本

88年3月29日修正

申請日期	86.07.29 88.8.25
案號	86110828
類別	COPY 249/241 49/1007

A4
C4

416942

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明名稱	中文	5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-2-[1-(乙氧亞胺基)丙基]-3-羥基環己-2-烯-1-酮之製程
	英文	A PROCESS OF PREPARING 5-(3-BUTYRYL-2,4,6-TRIMETHYLPHENYL)-2-[1-(ETHOXY-IMINO)PROPYL]-3-HYDROXYCYCLOHEX-2-EN-1-ONE
二、發明人	姓名	1. 葛拉翰柏德 2. 凱斯渥生
	國籍	均為澳洲
	住、居所	1. 澳洲維多利亞省波文市波文路 159 號 2. 澳洲維多利亞省舍利丘依拉莫街 23 號
三、申請人	姓名 (名稱)	澳洲艾西艾產銷公司
	國籍	澳洲
	住、居所 (事務所)	澳洲維多利亞省墨爾本尼可爾遜街 1 號
	代表人 姓名	大衛吉普生

裝

訂

線

416942

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大類：
IPC分類：

A6
B6

本案已向：

澳洲 國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ☒有 ☐無主張優先權
1996.7.30 P0 1322

有關微生物已寄存於：

，寄存日期：

，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明(1)

本發明有關一種化學製程。

歐洲專利第85529號揭示一種可用作選擇性除草劑之2-[1-(烷氧亞胺基)烷基]-5-(取代苯基)環己烷-1,3-二酮衍生物。

一具有結構式(I)之此種化合物5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-2-[1-(乙氧亞胺基)丙基]-3-羥基環己-2-烯-1-酮已發現為特別有用於選擇控制禾本科雜草。

歐洲專利第85529號論述此類型化合物之製備(雖然未揭示通式(I)化合物之本身)。

PCT申請案第W0 92/21649號揭示一種藉丁醯氯與一通式(III)化合物之反應製作通式(I)化合物之製程。

本發明提供一種替代之通式(I)化合物製程。

因此,本發明提供一種製備通式(I)化合物之製程,包含使一通式(IV)化合物與丁醯氯在有弗瑞德-克來福特反應觸媒存在時,於一惰性稀釋劑內反應以生成通式(II)化合物,並使此通式(II)化合物與乙氧胺反應。合宜之弗瑞德-克來福特觸媒包括氯化銨、氯化鐵、及氯化銨與氯化鐵之混合物。弗瑞德-克來福特觸媒較佳為無水氯化銨。弗瑞德-克來福特觸媒相對於通式(IV)化合物之用量為1至10摩爾比例,而較佳為3至5摩爾比例。丁醯氯相對於通式(IV)化合物之用量為1至10摩爾比例,較佳為1.5至2.5摩爾比例。

通式(IV)化合物與丁醯氯反應中所用稀釋劑可由已知用於弗瑞德-克來福特反應中之各種稀釋劑選出。舉例言

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (2)

之，其可爲一烴或一氯化烴，或者一硝基烴。合宜之脂肪族及脂環族烴實例包括以 Isopar M 商品名銷售之沸點範圍爲 210-250 °C 之脂肪族烴類、n-戊烷、n-庚烷、n-己烷、環庚烷與環己環之混合物。氯化烴類包括例如二氯甲烷及四氯乙烯。

硝基烴類包括例如硝基苯及硝基甲烷。

該反應較佳爲於 -10 至 100 °C 之溫度範圍而更佳爲 10 至 50 °C 之範圍實施。

在通式 (II) 化合物與乙氧胺之反應中，乙氧胺相對於通式 (II) 化合物之用量爲 0.5 至 5 摩爾比例，較佳爲 1.0 至 2.0 摩爾比例。

該反應較佳爲於 0 至 80 °C 之溫度範圍而更佳爲 20 至 50 °C 之範圍實施。

該反應適合在溶劑內實施，譬如 2-丙醇、環己烷、n-庚烷、n-辛烷、或芳香族烴譬如二甲苯或甲苯。

較佳之溶劑爲 n-庚烷或 2-丙醇。

該反應亦可在有觸媒存在時實施。合宜之觸媒包括有機錫化合物，譬如二乙酸二丁錫。

添加反應劑之順序可依需要予以改變。舉例言之，可將丁醯氯添加於在溶劑內之通式 (IV) 化合物及弗瑞德-克來福特觸媒，或者可繼添加通式 (IV) 化合物作爲溶劑後將丁醯氯添加於弗瑞德-克來福特觸媒漿液。

具有結構式 (II) 之 5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-3-羥基-2-丙醯基環己-2-烯-1-酮化合物係屬新穎，故而

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (3)

構成本發明之進一步方面。

通式 (IV) 化合物 3-羥基-2-丙醯基-5-(2,4,6-三甲基苯基)環己-2-烯-1-酮爲一已知之化合物。

曾意外發現，在弗瑞德-克來福特反應之前執行弗瑞德-克來福特反應大幅增加通式 (I) 化合物生產程序之產能。雖然 PCT 申請案第 W0 92/21649 號中所揭示之弗瑞德-克來福特反應需要 16 小時完成，在本發明中生成通式 (II) 化合物之弗瑞德-克來福特反應在僅僅 0.25 至 4 小時內完成。

若有需要，以上製程所生成之通式 (I) 化合物雖屬高品質，仍可藉結晶作用以無水溶劑進一步予以純化。此一結晶作用已述於歐洲專利第 488645 號中。將通式 (I) 化合物結晶成無水形式所用之較佳溶劑包括低沸點（例如高至 100 °C 之最大沸點）之烴類，例如環己烷、己烷、庚烷、及混合烴類。化合物 (I) 於該無水溶劑內溫熱至最大爲小於 80 °C 之溫度予以溶解，然後冷卻，此時將化合物 (I) 之無水結晶形式分離，並濾除且在真空下乾燥。一般而言，較佳爲製備化合物 (I) 之無水結晶形式，因其較易配製成除草組合物，且其較方便處理及運送。然而，若有需要，化合物 (I) 可以其結晶一水合物形式獲得，方法爲用含有一羥基團之含有小比例水之溶劑例如低分子烷醇，使本發明製程所得之化合物 (I) 結晶。如此所得結晶形式化合物 (I) 爲一水合物，熔點爲 30 °C；此物可於空氣中乾燥。

本發明係以下列實例予以例示。

實例 1

(請先閱讀背面之注意事項)
（爲本頁）

裝

訂

線

五、發明說明 (4)

此一實例例示使用布維爾特加成法生成通式(II)化合物。

於周圍溫度將化合物(IV)乾粉(28.6克, 100 重量%, 0.1 摩爾)溶於四氯乙烯(145 毫升)內。將溫度控制於20-25 °C (放熱性)以15分鐘時間分量次添加氯化鋁(53.3克, 100 重量%, 0.4 摩爾), 並攪拌混合物15分鐘。以15分鐘之時間添加 *n*-丁醯氯(21.3克, 100 重量%, 0.2 摩爾), 溫度維持於20-25 °C (放熱性)。反應混合物於20-25 °C 攪拌1 小時。將漿液生成物沒入水(190 克)及36%鹽酸(86克)中, 同時將溫度控制於40與45°C之間。水解混合物予多攪拌30分鐘, 讓其沉降並將各相位分離。於45-45 °C 將四氯乙烯層沖洗二次, 一次用水(150 克), 然後用10%碳酸氫鈉溶液(125 克), 並在每次沖洗後將各相位分離。以45-50 °C之批次溫度藉真空蒸餾(50毫米汞柱)將四氯乙烯移除。將穩定之氮氣流通過該溶液直到蒸餾終點, 以輔助去除最後之微量四氯乙烯。化合物(II)之收量為32.0克(89.9%)。

下表列示藉由在各種反應條件下及/或使用各種溶劑實施以上步驟之各項結果。

(請先閱讀背面之注意事項
再寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (5)

權

8-31

表 1

溶劑	反應濃度 [% w/w 基於化 合物 (IV)]	摩爾比 [化合物 (IV) = 1.0]		溫度 °C	添加 時間/分鐘	反應 時間/小時	% 轉化或 化合物 (II)
		AlCl ₃	丁噻氣				
二氯甲烷	13	4.0	2.0	30	15	0.75	100
四氯乙烯	11	4.0	2.0	50	15	0.5	99
四氯乙烯	8.5	4.0	2.0	25	45	2	98
四氯乙烯	8.5	3.5	2.0	45	60	1	98
四氯乙烯	8.5	4.0	2.0	20	60	3	97
硝基苯	9.0	4.0	2.0	20	60	2.5	98
環己烷	16	3.5	1.25	20	10	3	50
n-己烷	24	4.0	2.0	50	30	4	61
n-戊烷	24	4.0	2.0	25	15	4	97
環戊烷	24	4.0	2.0	35	15	2	89

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (6)

實例 2

此一實例例示使用布維爾特加成法生成通式(II)化合物。

於周圍溫度將化合物(IV)乾粉(28.6克, 100 重量%, 0.1 摩爾)溶於硝基苯(145 毫升)內。將溫度控制於20-25 °C (放熱性), 以15分鐘時間分量次添加氯化鐵(48.7克, 100 重量%, 0.3 摩爾), 並攪拌混合物15分鐘。以15分鐘之時間添加 *n*-丁醯氯(21.3克, 100 重量%, 0.2 摩爾), 溫度維持於20-25 °C (放熱性)。反應混合物於20-25 °C 攪拌1 小時。將漿液生成物沒入水(190 克)及36% 鹽酸(86克)中, 同時將溫度控制於55與60°C 之間。水解混合物予多攪拌30分鐘, 讓其沉降並將各相位分離。於55-60 °C 用水將硝基苯層沖洗二次, 各相位在每次沖洗後分離。

下表 2 列示藉由在各種反應條件下及 / 或使用各種溶劑實施以上步驟之各項結果。

(請先閱讀背面之注意事項
再寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (7)

修正
補充 本89年8月31日

表 2

溶劑	反應濃度 [% w/w 基於化合物 (IV)]	摩爾比 [化合物 (IV) = 1.0] FeCl ₃ 丁醇氯	溫度/°C	添加 時間/分鐘	反應 時間/小時	% 轉化成 化合物 (II)
硝基苯	14.5	3.0	20	15	1	90
硝基苯	14.5	3.0	20	15	3	37
硝基苯	14.5	4.0	20	15	0.75	99
硝基苯	20	4.0	20	15	1	99.5
硝基苯	23	4.0	20	15	0.25	95
n-庚烷	14.5	4.0	20	60	1	50

五、發明說明 (8)

實例 3

此一實例例示使用培利爾加成法生成通式(II)化合物。

於周圍溫度將氯化鋁(46.7克, 100 重量%, 0.35 摩爾)溶於二氯甲烷(90毫升)內。將溫度控制於18-22 °C (放熱性)以10分鐘時間分量次添加 n-丁醯氯(13.3克, 100 重量%, 0.125 摩爾), 並攪拌混合物30分鐘。以1小時時間添加化合物(IV)在二氯甲烷(40毫升)內之溶液(28.6克, 100 重量%, 0.1 摩爾), 反應溫度維持於20-25 °C (放熱性)。反應混合物於20-25 °C 攪拌2小時。將漿液緩慢轉移入水(190 克)與36%鹽酸(86克)之混合物中, 水解溫度控制於20-30 °C (放熱性)。水解混合物予多攪拌30分鐘, 讓其沉降並將各相位分離。於25-30 °C 用水(2×150克)沖洗二氯甲烷二次, 在每次沖洗後將各相位分離。以30-35 °C之批次溫度藉大氣壓蒸餾將二氯甲烷移除。化合物(II)之收量為33.7克(94.9%)。

下表3列示藉由在各種反應條件下及/或使用各種溶劑實施以上步驟之各項結果。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (9)

修正
補充 中華民國 81 年 5 月 31 日

溶劑	反應濃度 [% w/w 基於化合物 (IV)]	摩爾比 [化合物 (IV) = 1.0]		溫度 °C	添加 時間[化 合物 (IV)] / 分鐘	反應 時間/小時	% 轉化 化合物 (II)
		$AlCl_3$	丁噻氯				
二氯甲烷	13	3.5	1.25	20	30	2	90
二氯甲烷	13	3.5	1.2	20	30	0.5	99
硝基甲烷		3.5	1.25	20	30	2	60

表 3

五、發明說明(10)

實例 4

此一實例例示通式(I)化合物之生成。

於 40-45 °C 用 n-庚烷 (119 毫升) 將化合物(II)固體 (35.6克, 100 重量%, 0.1 摩爾) 製成漿。以 1 小時時間添加 50% 水性乙氧胺 (7.9 克, 100 重量%, 0.13 摩爾) 之溶液, 溫度維持於 40-45 °C。反應混合物於 40-45 °C 攪拌 4 小時。以 47-50 °C 批次溫度之真空蒸餾 (100 毫米汞柱), 用設置成將 n-庚烷共餾物送返至該批料之裝置將水移除。當所有固體均溶解時, 生成物溶液之共沸乾燥完畢。添加乾燥之 n-庚烷 (20-30 毫升) 將批料體積調整成 110 毫升。以 6 小時逐步冷卻至 5 °C (1 小時於 40°C, 2 小時於 30°C, 1 小時於 20°C 及 2 小時於 5 °C) 使無水生成物結晶。化合物(I)之收量為 31.6 克。

下表 4 列示藉由在各種反應條件下實施以上步驟之各項結果。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(11)

表 4

溶劑	反應濃度 [% w/w 基於化合物 (II)]	摩爾比 [化合物 1.0] (II) = 乙氧胺	溫度 °C	反應 時間 小時	% 轉化成 化合物 (I)
n-庚烷	30	1.3	25	4	99.5
n-庚烷	30	1.3	43	3	97
n-庚烷	37	1.3	45	2	97
四氫乙炔	16	1.3	42	4	99

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (12)

實例 5

此一實例例示通式 (I) 化合物之生成。

於 40-45 °C 將化合物 (II) 固體 (35.6 克 , 100 重量 % , 0.1 摩爾) 溶於 2-丙醇 (63 毫升) 內。以 1 小時時間添加 50 % 水性乙氧胺 (7.9 克 , 100 重量 % , 0.13 摩爾) 之溶液 , 溫度維持於 40-45 °C。反應混合物在冷卻至 10-15 °C 之前 , 於 40-45 °C 攪拌 4 小時。所得沉澱物 (生成物之一水合物形式) 藉過濾予以分離 , 並用 2-丙醇 (20 毫升) 繼以水 (2 × 35 毫升) 沖洗濾餅。該一水合物固體用 n-庚烷 (250 毫升) 製成漿 , 並以 47-50 °C 批次溫度之共沸真空蒸餾 (100 毫米汞柱) 將漿液乾燥。當所有固體均溶解時 , 生成物溶液之共沸乾燥完畢。添加乾燥之 n-庚烷 (20-30 毫升) 將批料體積調整成 100 毫升。以 6 小時逐步冷卻至 5 °C (1 小時於 40 °C , 2 小時於 30 °C , 1 小時於 20 °C 及 2 小時於 5 °C) 使無水生成物結晶。化合物 (I) 之收量為 27.5 克。

下表 5 列示藉由使用各種溶劑實施以上步驟之各項結果。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明(13)

表 5

溶劑	反應濃度 w/w 基於化合物 (II) [%]	摩爾比 [化合物 (II) = 1.0] 乙氧胺	溫度 / °C	反應時間 / 小時	% 轉化成 化合物 (I)
2-丙醇	42	1.3	38	3	99
環己烷	28	1.3	40	4	97
n-庚烷	30	1.3	40	4	92

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

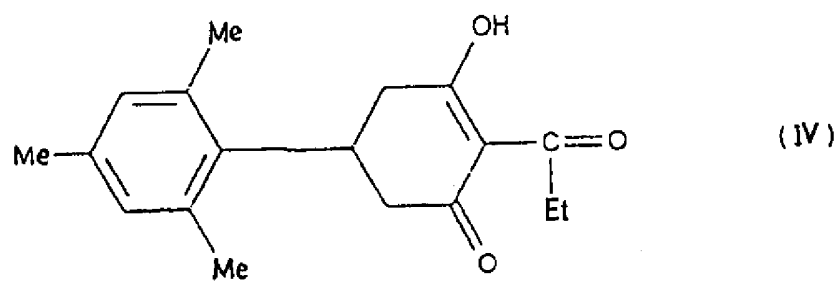
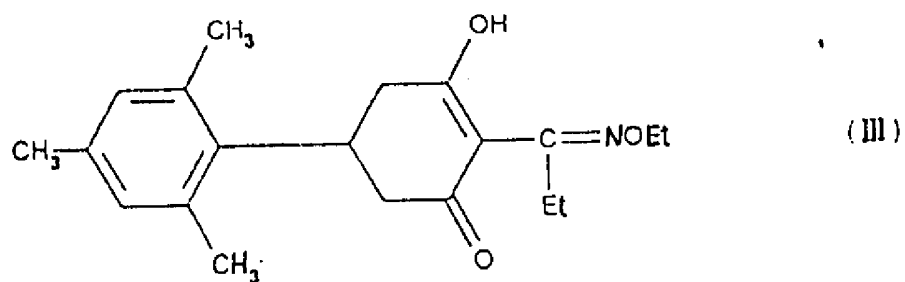
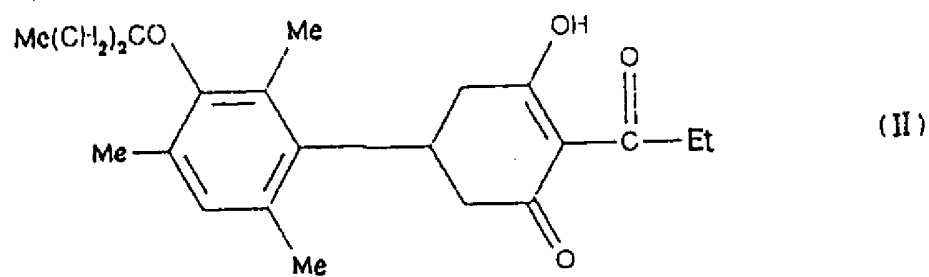
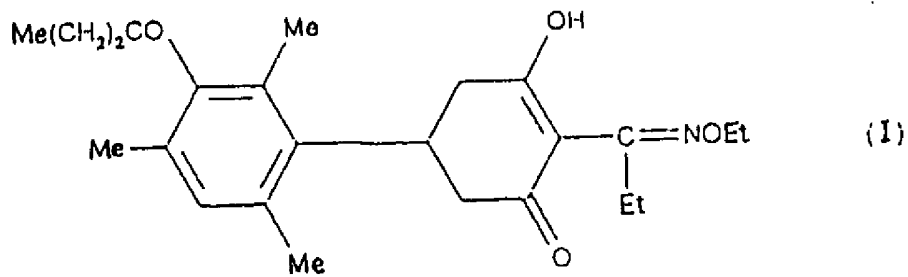
裝

訂

線

五、發明說明(14)

(說明書中之化學式)



四、中文發明摘要(發明之名稱: 5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-2-[1-(乙氧亞胺基)丙基]-3-羥基環己-2-烯-1-酮之製程

一種製備 5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-2-[1-(乙氧亞胺基)丙基]-3-羥基環己-2-烯-1-酮之製程,係使 3-羥基-2-丙醯基-5-(2,4,6-三甲基苯基)環己-2-烯-1-酮與丁醯氯在有弗瑞德-克來福特反應觸媒存在時,於一惰性稀釋劑內反應以生成 5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-3-羥基-2-丙醯基環己-2-烯-1-酮,並使此化合物與乙氧胺反應。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

英文發明摘要(發明之名稱:)

A PROCESS OF PREPARING 5-(3-BUTYRYL-2,4,6-TRIMETHYLPHENYL)
-2-[1-(ETHOXY-IMINO)PROPYL]-3-HYDROXYCYCLOHEX-2-EN-1-ONE

A process of preparing 5-(3-butyryl-2,4,6-trimethylphenyl)-2-[1-(ethoxyimino)propyl]-3-hydroxycyclohex-2-en-1-one by reacting 3-hydroxy-2-propionyl-5-(2,4,6-trimethylphenyl)cyclohex-2-en-1-one with butyryl chloride in the presence of a Friedel-Crafts reaction catalyst, in an inert diluent to produce 5-(3-butyryl-2,4,6-trimethylphenyl)-3-hydroxy-2-propionylcyclohex-2-en-1-one and reacting this compound with ethoxyamine.

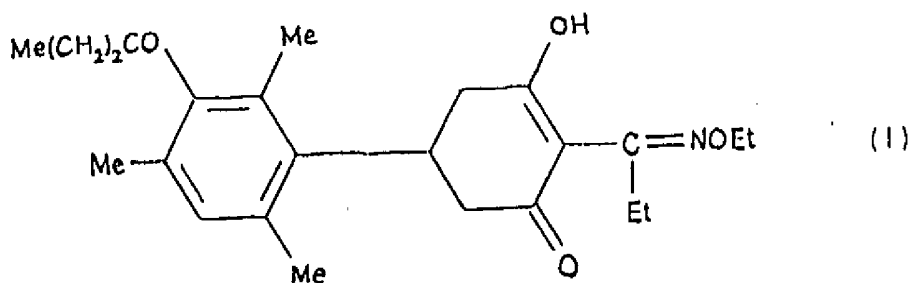
訂

線

六、申請專利範圍

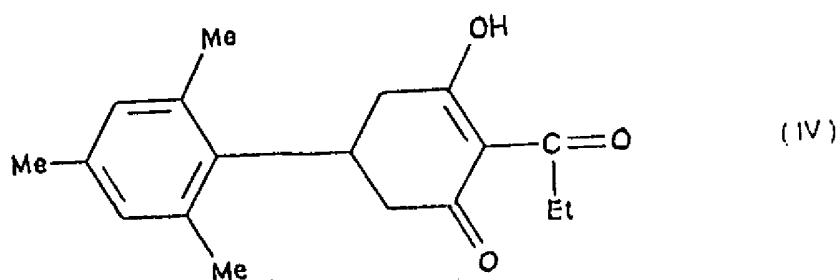
修正
補充 89年8月31日

1. 一種製備具有通式 (I) :

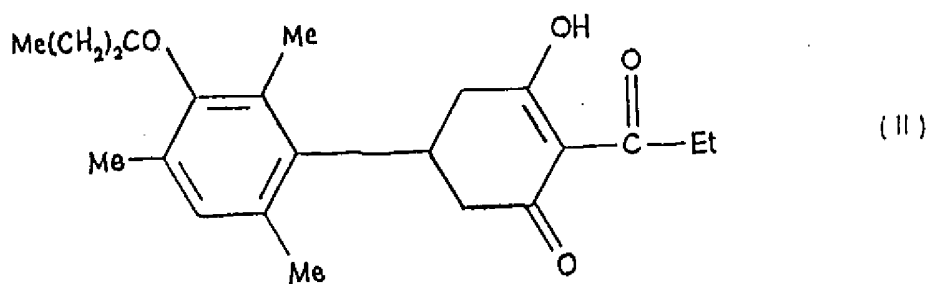


之化合物之製程，包含：

a) 使丁醯氯與具有通式 (IV) :



之化合物在有弗瑞德－克來福特反應觸媒存在時，於一惰性稀釋劑內反應，以生成具有通式 (II) :



之化合物，以及

b) 使通式 (II) 化合物與乙氧胺反應。

2. 如申請專利範圍第 1 項之製程，其中弗瑞德－克來福特觸媒為氯化鋁。

418942

A8
B8
C8
D8

六、申請專利範圍

3. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之製程，其中稀釋劑為脂肪族或脂環族烴，或為氯化之脂肪族烴。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

公告本

88年3月29日 修正
統

申請日期	86.07.29 88.8.25
案 號	86110828
類 別	COPY 249/241 49/1007

A4
C4

416942

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明名稱	中 文	5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-2-[1-(乙氧亞胺基)丙基]-3-羥基環己-2-烯-1-酮之製程
	英 文	A PROCESS OF PREPARING 5-(3-BUTYRYL-2,4,6-TRIMETHYLPHENYL)-2-[1-(ETHOXY-IMINO)PROPYL]-3-HYDROXYCYCLOHEX-2-EN-1-ONE
二、發明人	姓 名	1. 葛拉翰柏德 2. 凱斯渥生
	國 籍	均為澳洲
	住、居所	1. 澳洲維多利亞省波文市波文路159號 2. 澳洲維多利亞省舍利丘依拉莫街23號
三、申請人	姓 名 (名稱)	澳洲艾西艾產銷公司
	國 籍	澳洲
	住、居所 (事務所)	澳洲維多利亞省墨爾本尼可爾遜街1號
	代 表 人 姓 名	大衛吉普生

裝

訂

線

五、發明說明 (5)

權

8-31

表 1

溶劑	反應濃度 [% w/w 基於化 合物 (IV)]	摩爾比 [化合物 (IV) = 1.0]		溫度 °C	添加 時間/分鐘	反應 時間/小時	% 轉化 成 化合物 (II)
		AlCl ₃	丁噻氣				
二氯甲烷	13	4.0	2.0	30	15	0.75	100
四氯乙烯	11	4.0	2.0	50	15	0.5	99
四氯乙烯	8.5	4.0	2.0	25	45	2	98
四氯乙烯	8.5	3.5	2.0	45	60	1	98
四氯乙烯	8.5	4.0	2.0	20	60	3	97
硝基苯	9.0	4.0	2.0	20	60	2.5	98
環己烷	16	3.5	1.25	20	10	3	50
n-己烷	24	4.0	2.0	50	30	4	61
n-戊烷	24	4.0	2.0	25	15	4	97
環戊烷	24	4.0	2.0	35	15	2	89

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

五、發明說明 (7)

修正
補充 本89年8月31日

表 2

溶劑	反應濃度 [% w/w 基於化合物 (IV)]	摩爾比 [化合物 (IV) = 1.0] FeCl ₃ 丁醇氯	溫度/°C	添加 時間/分鐘	反應 時間/小時	% 轉化成 化合物 (II)
硝基苯	14.5	3.0	20	15	1	90
硝基苯	14.5	3.0	20	15	3	37
硝基苯	14.5	4.0	20	15	0.75	99
硝基苯	20	4.0	20	15	1	99.5
硝基苯	23	4.0	20	15	0.25	95
n-庚烷	14.5	4.0	20	60	1	50

五、發明說明 (9)

修正
補充 中華民國 81 年 8 月 31 日

溶劑	反應濃度 [% w/w 基於化合物 (IV)]	摩爾比 [化合物 (IV) = 1.0]		溫度 °C	添加 時間[化 合物 (IV)] / 分鐘	反應 時間/小時	% 轉化 化合物 (II)
		$AlCl_3$	丁噻氯				
二氯甲烷	13	3.5	1.25	20	30	2	90
二氯甲烷	13	3.5	1.2	20	30	0.5	99
硝基甲烷		3.5	1.25	20	30	2	60

表 3

四、中文發明摘要(發明之名稱: 5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-2-[1-(乙氧亞胺基)丙基]-3-羥基環己-2-烯-1-酮之製程

一種製備 5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-2-[1-(乙氧亞胺基)丙基]-3-羥基環己-2-烯-1-酮之製程,係使 3-羥基-2-丙醯基-5-(2,4,6-三甲基苯基)環己-2-烯-1-酮與丁醯氯在有弗瑞德-克來福特反應觸媒存在時,於一惰性稀釋劑內反應以生成 5-(3-丁醯基-2,4,6-三甲基苯基)-3-羥基-2-丙醯基環己-2-烯-1-酮,並使此化合物與乙氧胺反應。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

英文發明摘要(發明之名稱:)

A PROCESS OF PREPARING 5-(3-BUTYRYL-2,4,6-TRIMETHYLPHENYL)-2-[1-(ETHOXY-IMINO)PROPYL]-3-HYDROXYCYCLOHEX-2-EN-1-ONE

A process of preparing 5-(3-butyryl-2,4,6-trimethylphenyl)-2-[1-(ethoxyimino)propyl]-3-hydroxycyclohex-2-en-1-one by reacting 3-hydroxy-2-propionyl-5-(2,4,6-trimethylphenyl)cyclohex-2-en-1-one with butyryl chloride in the presence of a Friedel-Crafts reaction catalyst, in an inert diluent to produce 5-(3-butyryl-2,4,6-trimethylphenyl)-3-hydroxy-2-propionylcyclohex-2-en-1-one and reacting this compound with ethoxyamine.

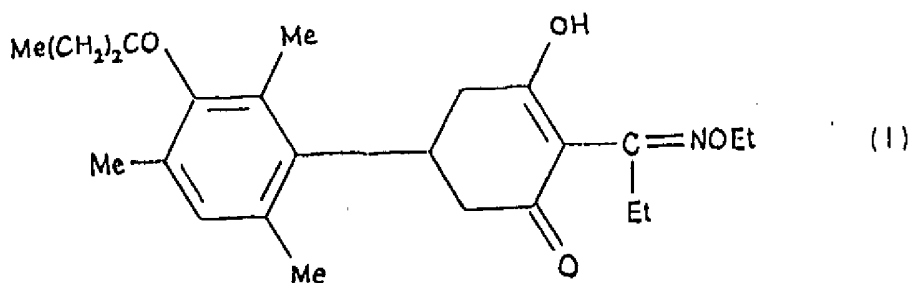
訂

線

六、申請專利範圍

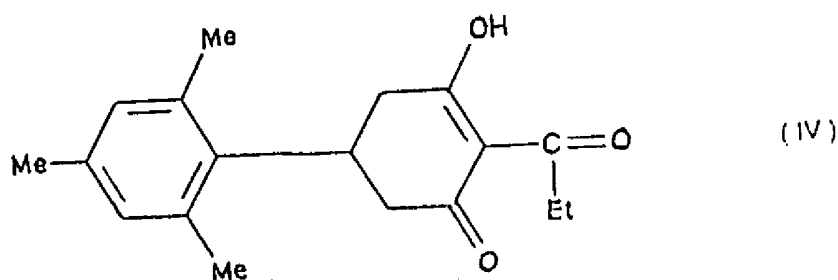
修正
補充 89年8月31日

1. 一種製備具有通式 (I) :

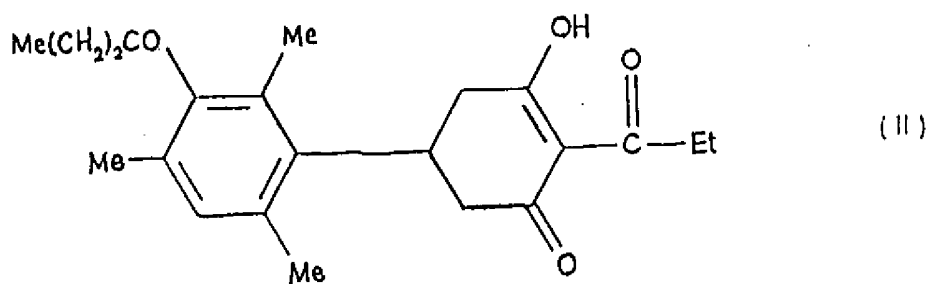


之化合物之製程，包含：

a) 使丁醯氯與具有通式 (IV) :



之化合物在有弗瑞德－克來福特反應觸媒存在時，於一惰性稀釋劑內反應，以生成具有通式 (II) :



之化合物，以及

b) 使通式 (II) 化合物與乙氧胺反應。

2. 如申請專利範圍第 1 項之製程，其中弗瑞德－克來福特觸媒為氯化鋁。