

【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 11 月 30 日 (2006.11.30)

【公表番号】特表 2006-506368 (P2006-506368A)

【公表日】平成 18 年 2 月 23 日 (2006.2.23)

【年通号数】公開・登録公報 2006-008

【出願番号】特願 2004-544849 (P2004-544849)

【国際特許分類】

C 0 7 D 453/02 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 453/02

C 0 7 B 61/00 3 0 0

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 10 月 10 日 (2006.10.10)

【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

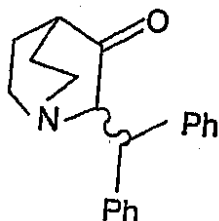
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

(S, S) - シス - 2 - ベンズヒドリル - 3 - ベンジルアミノ - キヌクリジンの調製方法であって、R - 異性体と S - 異性体との混合物を含有し、式：

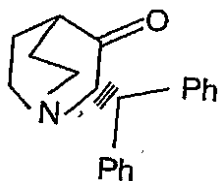
【化 1】



で示される化合物を、前記 R - 異性体を前記 S - 異性体の酸塩に転化させるために、有機溶媒の存在下の有効量のキラル有機酸及び有効量の有機カルボン酸と接触させる工程、前記有機溶媒は R - 異性体と S - 異性体との混合物を含有する前記化合物を可溶化させ、その一方で前記酸塩を沈殿させることができ、また前記有機カルボン酸は前記キラル有機酸とは異なるものである；

前記酸塩を塩基で中和して、式：

【化 2】



で示されるキラルケトンの S - 異性体を得る工程；並びに

前記キラルケトンを実質的に不活性なアルキルアミンと、ルイス酸の存在下で、反応させて、対応するイミンを得て、前記イミンを還元する工程

を含む方法。

【請求項 2】

前記化合物がラセミ混合物として存在する、請求項 1 記載の方法。

【請求項 3】

前記酸塩が (2S) - ベンズヒドリル - 3 - キヌクリジノンの酒石酸塩である、請求項 1 記載の方法。

【請求項 4】

前記キラル有機酸が L - 酒石酸である、請求項 1 記載の方法。

【請求項 5】

前記有機溶媒がアルコールである、請求項 1 記載の方法。

【請求項 6】

前記アルコールがエタノールである、請求項 5 記載の方法。

【請求項 7】

前記有機カルボン酸が酢酸、プロピオン酸又は酪酸である、請求項 1 記載の方法。

【請求項 8】

前記塩基が、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムである、請求項 1 記載の方法。

【請求項 9】

前記中和が二相性溶媒混合物の存在下で行なわれる、請求項 1 記載の方法。

【請求項 10】

前記ルイス酸がアルミニウム・トリイソプロポキシドである、請求項 1 記載の方法。

【請求項 11】

前記ルイス酸がチタン・テトライソプロポキシドである、請求項 1 記載の方法。

【請求項 12】

前記イミンを貴金属触媒の存在下での還元剤との反応によって還元する、請求項 1 記載の方法。

【請求項 13】

前記貴金属触媒が担持型パラジウム又は担持型白金触媒である、請求項 12 記載の方法。

【請求項 14】

前記アリールアルキルアミンがベンジルアミンである、請求項 1 記載の方法。

【請求項 15】

前記酸塩が 50 % を超える収率で製造される、請求項 1 記載の方法。

【請求項 16】

実質的にエナンチオマー的に純粋である、2(S) - ベンズヒドリル - 3 - キヌクリジノンの塩。

【請求項 17】

酒石酸塩である、請求項 16 記載の塩。

【請求項 18】

実質的にエナンチオマー的に純粋な 2(S) - ベンズヒドリル - 3 - キヌクリジノン。

【請求項 19】

実質的にエナンチオマー的に純粋な、2(S) - ベンズヒドリル - 3 - キヌクリジノンのイミン。