

(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
18. Oktober 2001 (18.10.2001)

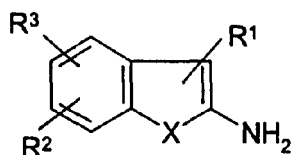
PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/77099 A1

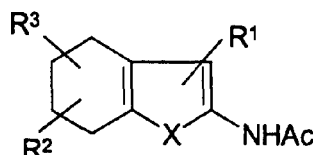
- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 333/68**
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/02672
- (22) Internationales Anmeldedatum:
9. März 2001 (09.03.2001)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
100 17 947.9 11. April 2000 (11.04.2000) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **MERCK PATENT GMBH** [DE/DE]; Frankfurter
Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **WARTENBERG,
Frank-Hardi** [DE/DE]; Liebfrauenstrasse 107, 64289
Darmstadt (DE). **KOPPE, Thomas** [DE/CH]; Im Lat-
ernenacker 5, CH-8200 Schaffhausen (CH). **WETZEL,
Walter** [DE/DE]; Jägertorstrasse 14, 64291 Darmstadt
(DE). **WYDRA, Markus** [DE/DE]; Alderstrasse 7, 63322
Rödermark (DE). **BENZ, Achim** [DE/DE]; Erzhäuser
Strasse 18, 64291 Darmstadt (DE).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH**;
Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE,
DK, DM, EE, 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, NO, NZ, PL,
PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).
- Veröffentlicht:**
— mit internationalem Recherchenbericht
- Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING BENZO ANNELATED HETEROCYCLES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG BENZO-ANNELIERTER HETEROCYCLEN



I



II

(57) **Abstract:** A method for producing benzo-annelated heterocycles of general formula (I), wherein X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ and n have the meaning cited in Claim 1, by reacting tetrahydrobenzo-annelated heterocycles of formula (II), wherein X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, n and Ac have the meaning cited in Claim 1, with a catalytic amount of an earth metal catalyst in the presence of a hydrogen acceptor and subsequently deacylating the acylated amino group by adding an amine.

(57) **Zusammenfassung:** Verfahren zur Herstellung von benzo-annelierten Heterocyclen der allgemeinen Formel (I), worin, X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und n eine in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, durch Umsetzung von tetrahydrobenzo-annelierten Heterocyclen der Formel (II), worin X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, n und Ac eine in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, mit einer katalytischen Menge eines Edelmetallkatalysators in Gegenwart eines Wasserstoffakzeptors und anschließender Deacylierung der acylierten Aminogruppe durch Zugabe eines Amins.

WO 01/77099 A1