

(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
29. Juni 2006 (29.06.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/066694 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 263/32 (2006.01) **A61P 3/00** (2006.01)
A61K 31/41 (2006.01)

Kelkheim (DE). **TAPPERTZHOFEN, Christoph**
[DE/DE]; Saalburgstrasse 30, 60385 Frankfurt (DE).
SCHEFFER, Robert, J., H. [NL/DE]; Stauferring 40,
55218 Ingelheim (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/012800

(22) Internationales Anmeldedatum:
1. Dezember 2005 (01.12.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 060 227.1
15. Dezember 2004 (15.12.2004) DE

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV,
LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI,
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC,
NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH**
[DE/DE]; Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt am Main
(DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **HOLLA, Wolfgang**
[DE/DE]; Kuckucksweg 7, 65779 Kelkheim (DE). **HO-**
ERLEIN, Rolf-Ludwig [DE/DE]; Assmannshäuser
Weg 21, 60529 Frankfurt (DE). **KULITZSCHER,**
Berndt [DE/DE]; Lindenstrasse 52, 97839 Steinmark
(DE). **LAUX, Wolfgang** [DE/DE]; Sachsenhaeuser
Landwehrweg 87, 60599 Frankfurt (DE). **STUEDE-**
MANN, Thomas [DE/DE]; Luisenstrasse 5a, 65779

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF OXAZOLES BY CONDENSING AROMATIC ALDEHYDES WITH A-KETOXIMES TO N-OXIDES AND THEN REACTING THE SAME WITH ACTIVATED ACID DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON OXAZOLEN DURCH KONDENSATION VON AROMATISCHEN ALDEHYDEN MIT α -KETOXIMEN ZU N-OXIDEN UND NACHFOLGENDE REAKTION MIT AKTIVIERTEN SÄUREREDERIVATEN

(57) Abstract: Disclosed is a method for producing oxazoles of formula IV by condensing aromatic aldehydes with a-ketoximes to N-oxides and then reacting the same with activated acid derivatives. The invention relates to a method for producing oxazoles by condensing aldehydes with a-ketoximes to N-oxides in the form of the salts thereof or as free bases and then reacting the same with activated acid derivatives so as to obtain oxazoles in the form of the salts thereof or as free bases.

(57) Zusammenfassung: Verfahren zur Herstellung von Oxazolen der Formel IV, durch Kondensation von aromatischen Aldehyden mit α -Ketoximen zu N-Oxiden und nachfolgende Reaktion mit aktivierten Säurerderivaten. Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von Oxazolen durch Kondensation von Aldehyden mit α -Ketoximen zu N-Oxiden in Form ihrer Salze oder als freie Basen und nachfolgende Reaktion mit aktivierten Säurerderivaten zu Oxazolen in Form ihrer Salze oder als freie Basen.

WO 2006/066694 A1