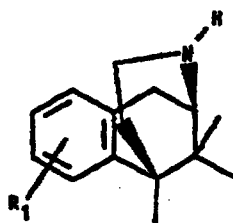


PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro

INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 221/26, 211/78, 211/70, C07C 229/34, C07D 211/74	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/06146 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 20. Februar 1997 (20.02.97)
(21) Internationales Aktenzeichen: ✓ PCT/EP96/03401 (22) Internationales Anmeldedatum: 2. August 1996 (02.08.96) (30) Prioritätsdaten: 195 28 472.0 ✓ 3. August 1995 (03.08.95) ✓ DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BOEHRINGER INGELHEIM KG [DE/DE]; Postfach 200, D-55216 Ingelheim am Rhein (DE). <i>PS SEE PCT/18/206</i> (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GRAUERT, Matthias [DE/DE]; In der Dörrwiese 62, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). MERZ, Herbert [DE/DE]; Rotweinstrasse 53, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). BALTES, Hanfried [DE/DE]; An der Oberschanze 1, D-55597 Wöllstein (DE).	(81) Bestimmungsstaaten: AU, BR, CA, CN, CZ, HU, JP, KR, MX, NO, NZ, PL, RU, <u>SG</u>, SI, TR, UA, US, VN, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht.	
(54) Title: METHOD OF PREPARING NORBENZOMORPHANE AS AN INTERMEDIATE IN THE PREPARATION OF PHAR- MACEUTICALLY USEFUL BENZOMORPHANE DERIVATIVES, IN PARTICULAR (-)-(1R,5S,2"R)-3'-HYDROXY-2-(2- METHOXYPROPYL)-5,9,9-TRIMETHYL-6,7-BENZOMORPHANE ✓ (54) Bezeichnung: NEUES VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON NORBENZOMORPHAN EINER ZWISCHENSTUFE BEI HERSTELLUNG VON PHARMAZEUTISCH WERTVOLLEN BENZOMORPHANDERIVATEN, INSBESONDERE VON (-)-(1R,5S,2"R)-3'-HYDROXY-2-(2-METHOXYPROPYL)-5,9,9-TRIMETHYL-6,7-BENZOMORPHAN (57) Abstract The invention concerns a method of preparing norbenzomorphane in the central intermediate stage in the preparation of pharmaceutically useful benzomorphane derivatives of general formula (1), in particular (-)-(1R,5S,2"R)-3'-hydroxy- 2-(2-methoxypropyl)-5,9,9- trimethyl-6,7-benzomorphane or [(-)-(2R,6S,2'R)-3-(2-methoxypropyl)-6,11,11-trimethyl-1,2,3,4,5,6-hexahydro-2,6-methanobenzo[α]oxacin-9-ol] (BIII 277). (57) Zusammenfassung Die vorliegende Erfindung betrifft ein neues Verfahren zur Herstellung von Norbenzomorphan - der zentralen Zwischenstufe bei der Herstellung von pharmazeutisch wertvollen Benzomorphanderivaten der allgemeinen Formel (1), insbesondere von (-)-(1R,5S,2"R)-3'- Hydroxy-2-(2-methoxypropyl)-5,9,9-trimethyl-6,7-benzomorphane bzw. [(-)-(2R,6S,2'R)-3-(2-Methoxypropyl)-6,11,11-trimethyl-1,2,3,4,5,6- hexahydro-2,6-methano-benzo[α]oxacin-9-ol] (BIII 277).		



(1)