(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
19. August 2004 (19.08.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/069836 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 487/04

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/000485

(22) Internationales Anmeldedatum:
22. Januar 2004 (22.01.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 04 141.9 3. Februar 2003 (03.02.2003) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **HF ARZNEIMITTELFORSCHUNG GMBH** [DE/DE]; St. Johannes 5, 59368 Werne (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **MOORMANN, Joachim** [DE/DE]; Schulstrasse 5, 59368 Werne (DE). **HOFFMANN, Hans-Rainer** [DE/DE]; Burghofstrasse 123, 56566 Neuwied (DE). **MATUSCH, Rudolf** [DE/DE]; Am Hasenküppel 18 A, 35041 Marburg (DE).

(74) Anwalt: **FLACCUS, Rolf-Dieter**; Bussardweg 12, 50389 Wesseling (DE).

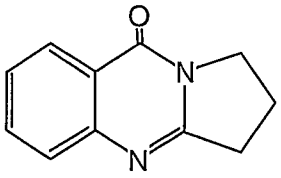
(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, 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,

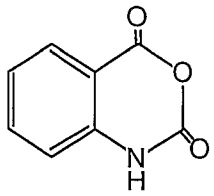
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHODS FOR PRODUCING QUINAZOLINE ALKALOIDS

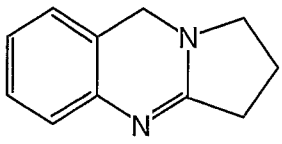
(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON CHINAZOLIN-ALKALOIDEN



(I)



(II)



(III)

(57) Abstract: The invention relates to a method for producing a compound of formula (I) by reacting a compound of formula (II) with 2-pyrrolidone, whereby a surplus of 2-pyrrolidone, in relation to compound (II), is used. The invention also relates to a method for producing a compound of formula (III), comprising the following steps: (A) production of compound (I); (B) reduction reaction to obtain compound (III) in the form of a salt; (C) release of compound (III) from the salt.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft Verfahren zur Herstellung einer Verbindung der nachfolgenden Formel (I) durch Umsetzung einer Verbindung der Formel (II) mit 2-Pyrrolidon, wobei 2-Pyrrolidon, bezogen auf Verbindung (II), im Überschuss eingesetzt wird; sowie Verfahren zur Herstellung einer Verbindung der nachfolgenden Formel (III), welche folgende Schritte umfasst: (A) Herstellung von Verbindung (I); (B) Reduktionsreaktion, wobei Verbindung (III) in Salzform erhalten wird; (C) Freisetzung von Verbindung (III) aus dem Salz.

WO 2004/069836 A1

GH, GM, KE, LS, MW, MZ, 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, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, 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, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO Patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)*

— *Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US*

Veröffentlicht:

— *mit internationalem Recherchenbericht*

— *vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen*

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.