

Tillæg til Dansk Patenttidende nr. 41/8-10-84

C 07 C 39

Ans.nr.: 0823/84

Indleveret: 21 feb 1984

Løbedag: 21 feb 1984

Alm. tilgængelig: 23 aug 1984

Prioritet: 22 feb 1983 US 468616

*PFIZER INC.; New York, US.

Opfinder: Frank John *Urban; US.

Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af chiralt 3-(2-hydroxy-4-(1,1-dimethylheptyl)-phenyl)-4-(3-hydroxypropyl)cyclohexanol og forbindelser til anvendelse som mellemprodukter ved fremgangsmåden

SAMMENDRAG:

823-84

Fremstilling af chiralt 3R-[2-hydroxy-4-(1,1-dimethylheptyl)phenyl]-4R-(3-hydroxypropyl)-1R-cyclohexanol ud fra racemisk endo- eller exo-1-methoxybicyclo[2.2.2]oct-5-en-2-carboxylsyre, som adskilles optisk ved krystallisation af henholdsvis (+)-ephedrin- eller (-)-ephedrin-saltet fra et opløsningsmiddel, hvorpå den optisk rene (-)-endo- eller (-)-exo-syre frigøres fra saltet og esterificeres med en (C₁-C₃)-alkanol, 1-methoxy-gruppen demethyleres med bortribromid, og det dannede (C₁-C₃)alkyl-(+)-endo- eller (-)-exo-1-hydroxybicyclo[2.2.2]oct-5-en-2-carboxylat underkastes en særlig basekatalyseret omlejring til dannelsen af (C₁-C₃)alkyl-5-β-[4-(2-cyclohexanon)]-propionat. Dette omdannes til den ønskede forbindelse ved reduktion af ketongruppen til en hydroxygruppe, reduktion af carboxylatergruppen til en carbinolgruppe og debenzylering, fortrinvis i rækkefølge ved mild

Uddrag af patentansøgninger. Sektion C 07 og C 12

hydridreduktion, stærk hydridreduktion og hydrogenering over en ædelmetalkatalysator.

Den fremstillede chirale forbindelse har værdifuld CNS-aktivitet, især som analgeticum og antiemeticum, og den opnås i højere udbytter end ved de kendte fremgangsmåder.