



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan **912280**

(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5

C 07D 333/20, C 07C 215/30

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag **10.05.91**

(24) Alkuperäisyys - Löpdag **10.05.91**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig **18.11.91**

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

17.05.90 US 524512 P

(71) Hakija - Sökande

1. Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, Ind., USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Staszak, Michael Alexander, 4515 North Lakeridge Drive, Indianapolis, Ind., USA, (US)

2. Staten, Gilbert Stanley, 74 Staten Lane, Camby, Ind. 46113, USA, (US)

3. Weigel, Leland Otto, 7501 Chatterton Drive, Indianapolis, Ind. 46254, USA, (US)

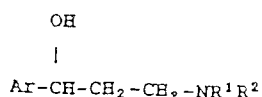
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

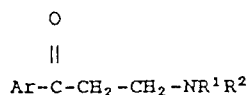
1-aryyli-3-aminopropan-1-olien kiraalinen synteesi
Kiral syntes av 1-aryl-3-aminopropan-1-oler

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee menetelmää kiraalisten β -aminoalkoholien valmistamiseksi, joilla on kaava

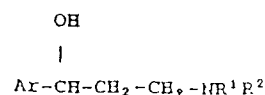


jossa Ar on fenyyli tai tienyyli ja R^1 ja R^2 on toisistaan riippumatta valittu C_1 - C_3 -alkyylistä ja fen(C_1 - C_3)-alkyylistä, (a) saattamalla akiraalinen Mannich-ketoni, jolla on kaava

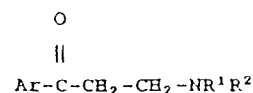


reagoimaan kompleksin kanssa, joka on saatu saattamalla litiumaluminiumhydridi reagoimaan (2R,3S)-(-)-4-dimetyyliamino-1,2-difenyyli-3-metyyli-2-butanolin kanssa toluenissa; ja b) ottamalla siitä talteen mainittu kiraalinen β -aminoalkoholi. Nämä yhdisteet ovat tärkeitä välituotteita farmakologisesti aktiivisten yhdisteiden synteesissä.

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av kirala β -aminoalkoholer med formeln



vari Ar är fenyl eller tienyl och R^1 och R^2 är självständigt valda bland C_1 - C_3 -alkyl och fen(C_1 - C_3)-alkyl, (a) genom att omsätta en chiral Mannich-keton med formeln



med ett komplex, vilket erhållits genom omsättning av litiumaluminiumhydrid med (2R,3S)-(-)-4-dimetylamino-1,2-difenyl-3-metyl-2-butanol i toluen; och b) tillvaratagnade av nämnda kirala β -aminoalkohol. Dessa föreningar är viktiga mellanprodukter i syntesen av farmakologiskt aktiva föreningar.