



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012116208/04, 23.03.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
23.09.2009 CN PCT/CN2009/074125

(43) Дата публикации заявки: 10.11.2013 Бюл. № 31

(85) Дата начала рассмотрения заявки PCT на
национальной фазе: 23.04.2012(86) Заявка PCT:
CN 2010/071243 (23.03.2010)(87) Публикация заявки PCT:
WO 2011/035569 (31.03.2011)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной

(71) Заявитель(и):

ЧЖЭЦЗЯН ЦЗЮЧЖОУ
ФАРМАСЬЮТИКЛ КО., ЛТД. (CN),
НОВАРТИС АГ (CH)

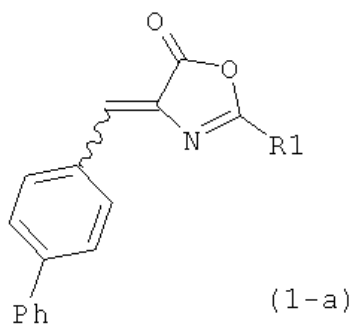
(72) Автор(ы):

ЧЖУ Гуолян (CN),
ШИ Дэсун (CN),
ВЭЙ Юньсюй (CN),
ТАО Фэнфэн (CN)

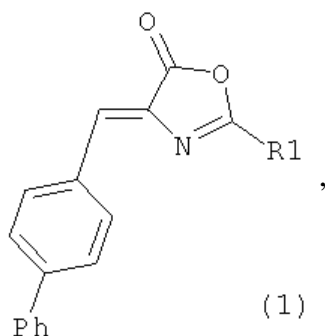
(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ N-АЦИЛБИФЕНИЛАЛАНИНА

(57) Формула изобретения

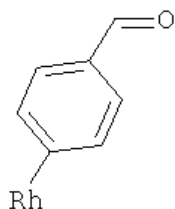
1. Способ получения соединения формулы (1-a) или его соли



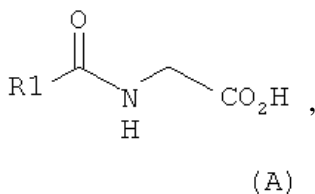
где соединение формулы (1-a) предпочтительно отвечает формуле (1)



и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, включающий взаимодействие



или его соли с соединением формулы (A)

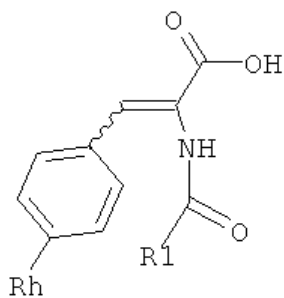


или его солью, в котором R1 отвечает определению для соединения формулы (1-a), и (R₂CO)₂O, в котором R₂ представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил или пропил, в щелочных условиях с целью получения соединения формулы (1-a).

2. Способ по п.1, в котором щелочные условия включают применение основания, выбранного из триэтиламина, пиридина, N-метилпиррола, N-метилморфолина, гидрокарбоната натрия, карбоната натрия, гидрокарбоната калия, карбоната калия, ацетата натрия, ацетата калия, пропионата натрия и пропионата калия.

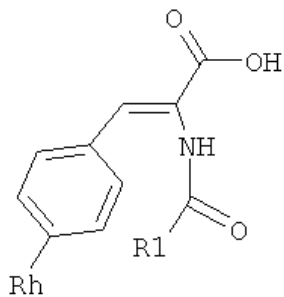
3. Способ по п.1 или 2, в котором взаимодействие осуществляют при температуре от 80°C до температуры кипения с обратным холодильником.

4. Способ получения соединения формулы (2-a) или его соли



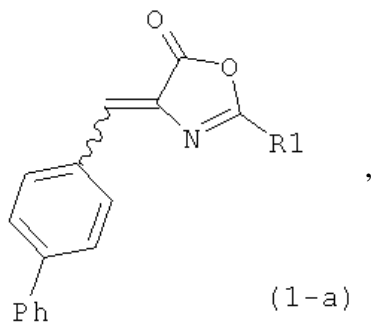
(2-a)

где соединение формулы (2-a) предпочтительно отвечает формуле (2)



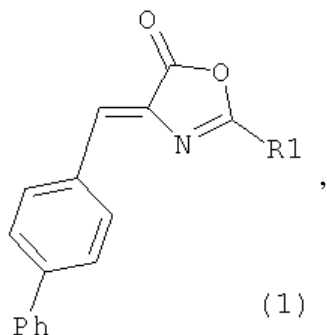
(2)

и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, включающий взаимодействие соединения формулы (1-a) или его соли



(1-a)

где соединение формулы (1-a) предпочтительно отвечает формуле (1)

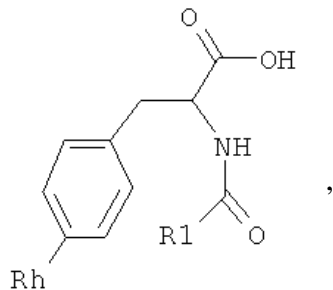


(1)

и где R1 отвечает определению для соединения формулы (2-a), с водой с целью получения соединения формулы (2-a).

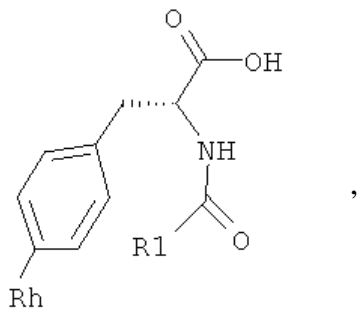
5. Способ по п.4, в котором взаимодействие осуществляют при температуре от комнатной температуры до температуры кипения с обратным холодильником.

6. Способ получения соединения формулы (3) или его соли



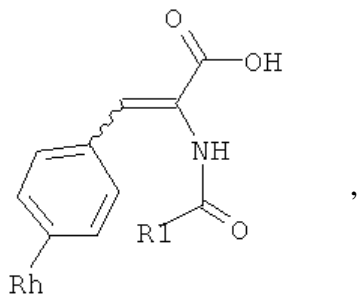
(3)

где соединение формулы (3) предпочтительно отвечает формуле (3-a)



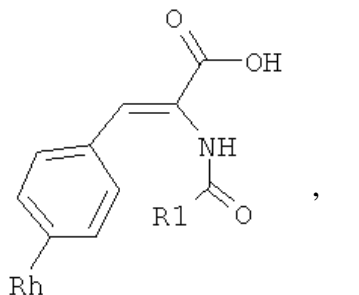
(3-a)

и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, включающий обработку соединения формулы (2-a) или его соли



(2-a)

где соединение формулы (2-a) предпочтительно является соединением формулы (2)

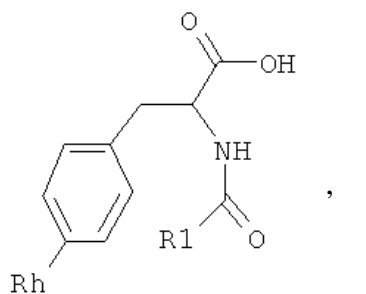


(2)

и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, в условиях гидрирования с целью получения соединения формулы (3).

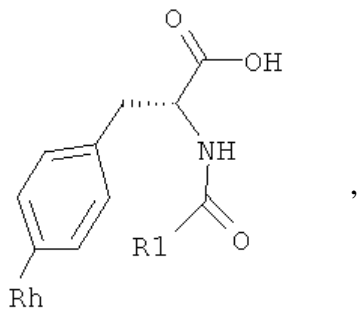
7. Способ по п.6, в котором условия гидрирования включают применение водорода и палладия, предпочтительно палладия на активированном угле.

8. Способ получения соединения формулы (3), или его соли



(3)

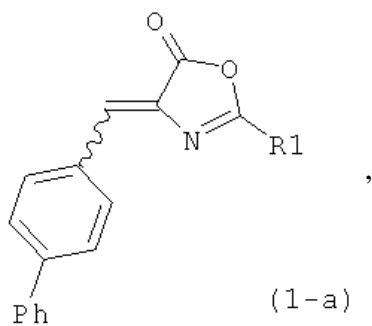
где соединение формулы (3) предпочтительно отвечает формуле (3-a)



(3-a)

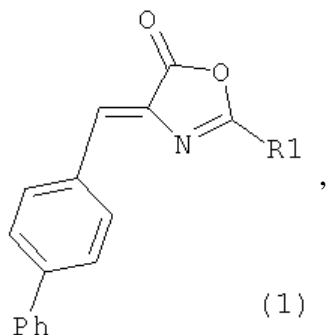
и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, включающий стадии

1) получения соединения формулы (1-a) или его соли



(1-a)

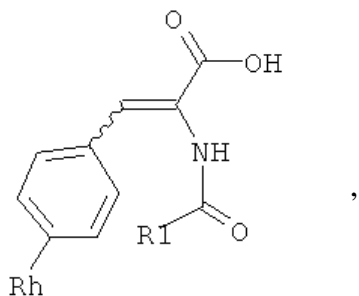
где соединение формулы (1-a) предпочтительно отвечает формуле (1)



(1)

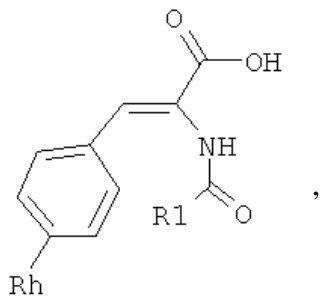
и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, согласно любому из способов, определенных в пп.1-3, предпочтительно, согласно способу, определенному в п.1,

2) получения соединения формулы (2-a), или его соли



(2-a)

где соединение формулы (2-a) предпочтительно отвечает формуле (2)

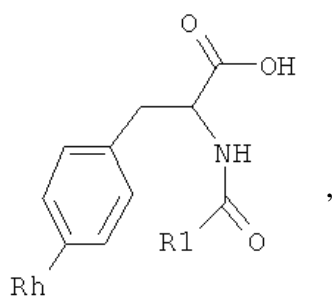


(2)

и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, согласно способу, определенному в п.4 или 5, предпочтительно согласно способу, определенному в п.4, и

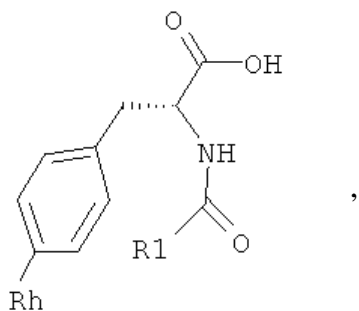
3) получения соединения формулы (3), согласно способу, определенному в п.6 или 7.

9. Способ получения соединения формулы (3) или его соли



(3)

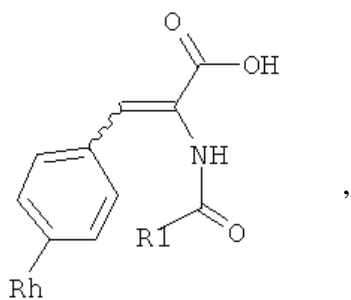
где соединение формулы (3) предпочтительно отвечает формуле (3-a)



(3-a)

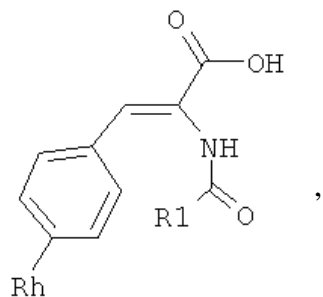
и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, включающий стадии

2) получения соединения формулы (2-a), или его соли



(2-a)

где соединение формулы (2-а) предпочтительно отвечает формуле (2)

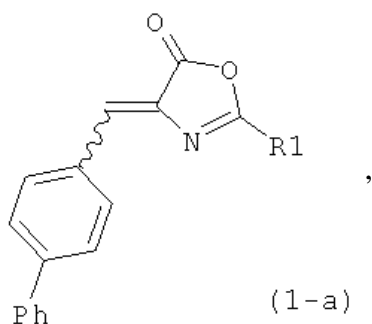


(2)

и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил, согласно способу, определенному в п.4 или 5, предпочтительно согласно способу, определенному в п.4, и

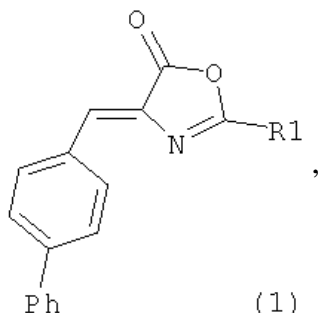
3) получения соединения формулы (3), согласно способу, определенному в п.6 или 7.

10. Соединение формулы (1-а) или его соль



(1-a)

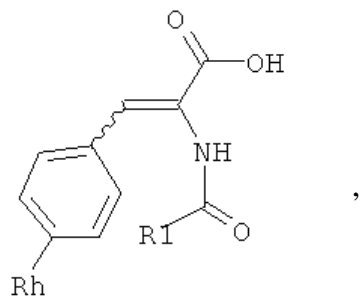
где соединение формулы (1-а) предпочтительно отвечает формуле (1)



(1)

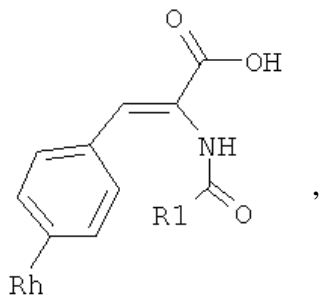
и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил.

11. Соединение формулы (2-а) или его соль



(2-a)

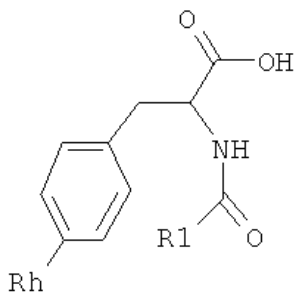
где соединение формулы (2-а) предпочтительно отвечает формуле (2)



(2)

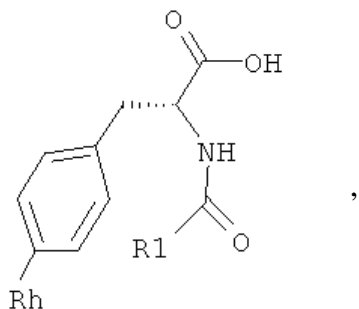
и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил, предпочтительно метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил.

12. Соединения формулы (3) или его соль



(3)

где соединение формулы (3) предпочтительно отвечает формуле (3-a)



(3-a)

и где R1 представляет собой (C₁-C₇)алкил предпочтительно, метил, или (C₆-C₁₀)арил, предпочтительно фенил.

RU 2012116208 A

RU 2012116208 A