



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20200437 T1



HR P20200437 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

C07D 211/60 (2006.01)

C07D 211/56 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 04.09.2020.

(21) Broj predmeta: P20200437T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 17.03.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2014053176
Datum podnošenja međunarodne prijave: 19.02.2014.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 14705501.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 19.02.2014.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2014128139
Datum međunarodne objave: 28.08.2014.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2958894 A1
Datum objave europske prijave patenta: 30.12.2015.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2958894 B1
Datum objave europskog patenta: 18.12.2019.

(31) Broj prve prijave: 13156030

(32) Datum podnošenja prve prijave: 20.02.2013.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

**Reuter Chemische Apparatebau e.K., Engesserstrasse 4b, 79108
Freiburg, DE**

(72) Izumitelji:

**Karl Reuter, Lindenstr. 35, 79194 Gundelfingen, DE
Tobias Wedel, Klara-Siebert-Str. 17, 76137 Karlsruhe, DE
Viktor Meier, Lindenstr. 16, 79194 Gundelfingen, DE
Mark Kantor, Auwaldstr. 5, 79110 Freiburg, DE
Vasyl Andrushko, Luise-Riegger-Str. 56, 76137 Karlsruhe, DE
Florian Stolz, Gereut 10, 79211 Denzlingen, DE**

(74) Zastupnik:

ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

PROCES ZA PRIPREMU ENANTIOMEROM OBOGAĆENOG 3-AMINOPIPERIDINA

HR P20200437 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Postupak za pripremu 3-aminopiperidina, koji postupak uključuje sljedeće korake:
 - a) dobivanje hidrazida piperidin-3-karboksilne kiseline, i
 - b) pretvaranje hidrazida piperidin-3-karboksilne kiseline u piperidin-3-karbonil azid reakcijom hidrazida piperidin-3-karboksilne kiseline s nitritom u prisutnosti kiseline, i
 - c) reakciju piperidin-3-karbonil-azida u prisutnosti vode i kiseline, pri čemu se piperidin-3-karbonil-azid pretvara u 3-aminopiperidin, gdje se koraci b) i c) provode bez izolacije piperidin-3-karbonil-azida.
2. Postupak prema zahtjevu 1, naznačen time što korak a) obuhvaća reakciju C₁-C₄-alkilestera ili benzilestera piperidin-3-karboksilne kiseline, posebno etilnog estera piperidin-3-karboksilne kiseline s hidrazinom.
3. Postupak prema zahtjevu 1 ili 2, naznačen time, da se hidrazid piperidin-3-karboksilne kiseline daje u neracemičnoj smjesi njihovih enantiomera, pri čemu je smjesa enantiomerno obogaćena s obzirom na jedan od njenih enantiomera.
4. Postupak prema zahtjevu 3, gdje C₁-C₄-alkilester piperidin-3-karboksilne kiseline, posebno etilni ester piperidin-3-karboksilne kiseline, koji je enantiomerno obogaćen s obzirom na jedan od njegovih enantiomera, reagira sa hidrazinom.
5. Postupak prema zahtjevu 4, naznačen time što korak a) obuhvaća podvrgavanje racemične C₁-C₄-alkilestere piperidin-3-karboksilne kiseline, posebno racemičnog etil estera piperidin-3-karboksilne kiseline, da bi se enantiomerno obogaćivalo s obzirom na R-enantiomer frakcijskom kristalizacijom kisele adicijske soli C₁-C₄-alkilestera piperidin-3-karboksilne kiseline s kiralnom kiselinom.
6. Postupak prema zahtjevu 5, naznačen time da je kiralna kiselina vinska kiselina ili mandelinska kiselina, posebno L-vinska kiselina ili D-mandelinska kiselina.
7. Postupak prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, naznačen time da korak b) uključuje reakciju hidrazida piperidin-3-karboksilne kiseline s organskim nitritom, u prisutnosti kiseline.
8. Postupak prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, naznačen time što je 3-aminopiperidin izoliran iz koraka c) kao njegov dihidroklorid ili dihidroklorid monohidrata.
9. Neracemični hidrazid piperidin-3-karboksilne kiseline, koji je enantiomerno obogaćen bilo s obzirom na njegov R-enantiomer ili s obzirom na njegov S-enantiomer, te njegove kiselinske adicijske soli i hidrati.
10. Piperidin-3-karbonil azid.
11. Neracemični piperidin-3-karbonil azid, koji je enantiomerno obogaćen bilo s obzirom na svoj R-enantiomer ili s obzirom na njegov S-enantiomer.