



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2009128063/04, 21.12.2007

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
21.12.2006 US 60/876,251

(43) Дата публикации заявки: 27.01.2011 Бюл. № 3

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 21.07.2009(86) Заявка РСТ:
US 2007/026257 (21.12.2007)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2008/079380 (03.07.2008)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул.Б.Спаская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", А.В.Мицу

(71) Заявитель(и):

ЭББОТТ ЛЭБОРЕТРИЗ (US)

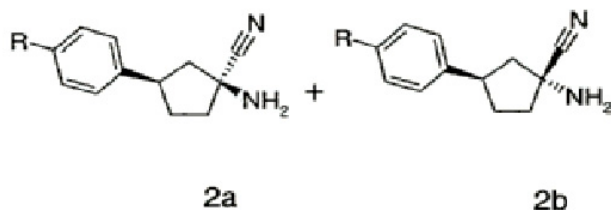
(72) Автор(ы):

ГОРДОН Томас Д. (US),
УОЛЛЕЙС Грив А. (US),
ХЭЙЗ Мартин Е. (US),
ЛУКИН Кирилл А. (US),
ВАН Лэй (US),
ФЕРНАНДО Дилини П. (US)

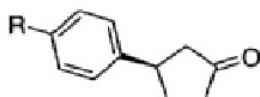
(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ И ВЫДЕЛЕНИЯ ОТДЕЛЬНЫХ СТЕРЕОИЗОМЕРОВ 1-АМИНО, 3-ЗАМЕЩЕННЫХ ФЕНИЛЦИКЛОПЕНТАНЕКАРБОКСИЛАТОВ

(57) Формула изобретения

1. Способ для получения смеси соединения Формулы 2a и Формулы 2b,

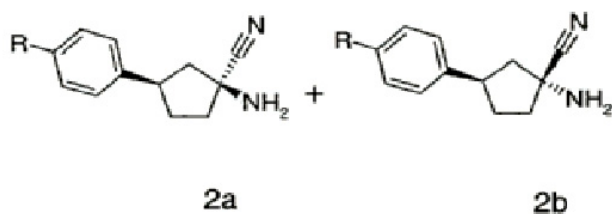


содержащий стадию взаимодействия соединения формулы 1



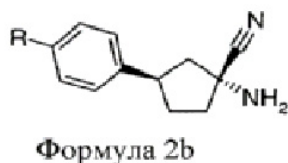
Формула 1

с аммиаком и цианидной солью, по существу, до завершения реакции, для
образования смеси соединения Формул 2a и 2b



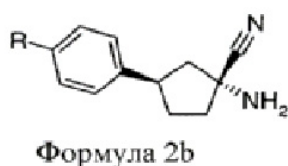
в которых R представляет собой Br или метокси.

2. Способ для выделения соединения Формулы 2b

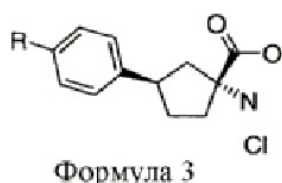


в которой R представляет собой Br или метокси, включающий в себя стадии образования соли с L-тартаровой кислотой и выделение смеси диастереомерных солей, основываясь на различной растворимости в растворителе.

3. Способ для получения соединения Формулы 3, включающий стадии взаимодействия соединения Формулы 2b

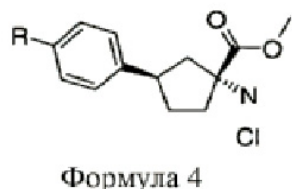


с водной HCl и диоксаном, по существу, до завершения реакции, для выделения соединения Формулы 3

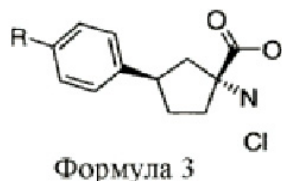


в которой R представляет собой Br или метокси.

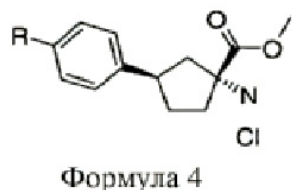
4. Способ для получения соединения Формулы 4



включающий в себя стадии взаимодействия соединения Формулы 3

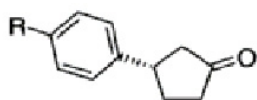


с метанолом или тионилхлоридом, по существу, до завершения реакции, для образования соединения Формулы 4



в которой R представляет собой Br или метокси.

5. Способ для получения соединения Формулы 5

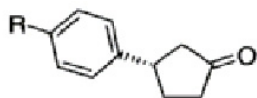


Формула 5

включающий в себя стадии взаимодействия замещенной арилбороновой кислоты и родиевого катализатора с (R)- или (S)-BINAP в органическом растворителе, воде, которые дегазированы азотом, и добавления циклоалканона формулы



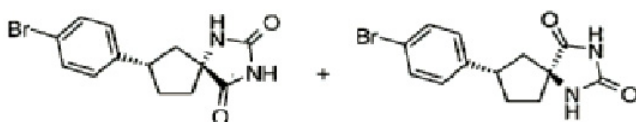
по существу, до завершения реакции для образования соединения Формулы 5



Формула 5

в которой R представляет собой Br или метокси.

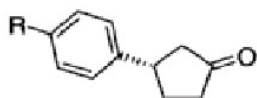
6. Способ для получения смеси соединений Формул 6a и 6b,



Формула 6a

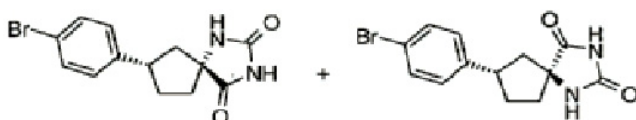
Формула 6b

включающий в себя стадии взаимодействия смеси карбоната аммония и цианидной соли в воде с соединением Формулы 5



Формула 5

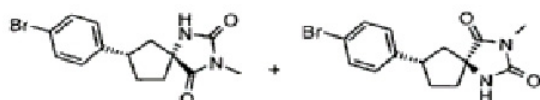
в которой R представляет собой Br, в основном, до завершения реакции, для образования смеси соединения Формул 6a и 6b



Формула 6a

Формула 6b

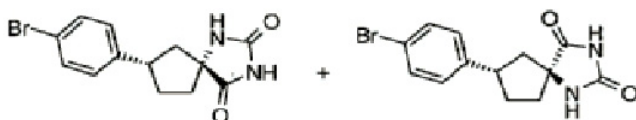
7. Способ для получения смеси соединений Формулы 7a и 7b



Формула 7a

Формула 7b

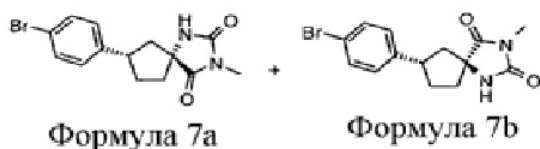
включающий в себя стадии взаимодействия смеси соединений формулы 6a и формулы 6b



Формула 6a

Формула 6b

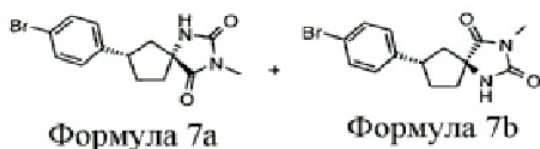
с карбонатом калия и алкилирующим веществом, по существу, до завершения реакции для получения смеси соединений Формулы 7a и 7b



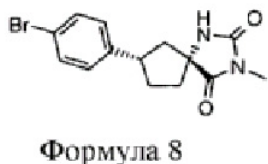
8. Способ для выделения соединения Формулы 8



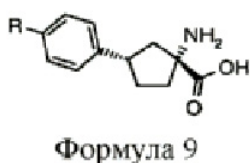
включающий в себя стадии растворения смеси соединений формулы 7a и формулы 7b



в горячем ацетонитриле и затем охлаждения раствора, по существу, до завершения реакции, для получения соединения Формулы 8



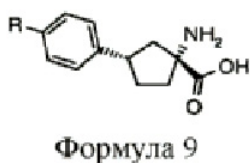
9. Способ для получения соединения Формулы 9



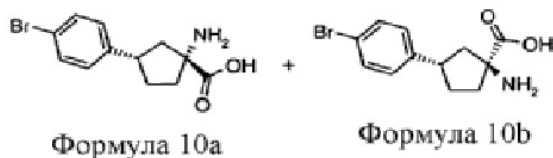
включающий в себя стадии гидролиза соединения Формулы 8



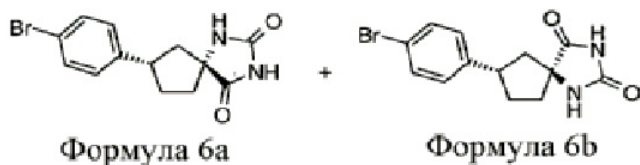
водным основанием, по существу, до завершения реакции, для получения соединения Формулы 9



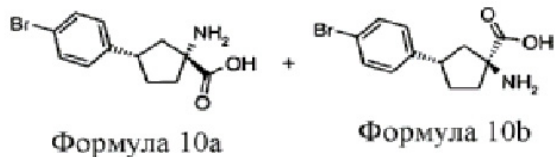
10. Способ для получения смеси соединений формулы 10a и 10b



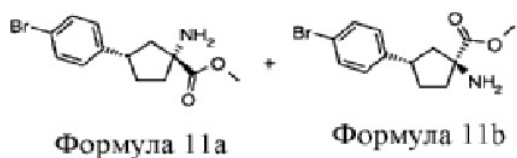
включающий в себя обработку смеси соединений формулы 6a и 6b



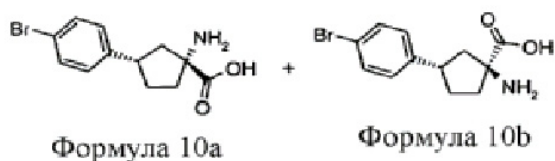
неорганической основой, по существу, до завершения реакции для образования смеси соединений формулы 10a и 10b



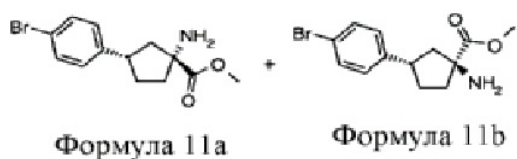
11. Способ для получения смеси соединений Формулы 11a и 11b



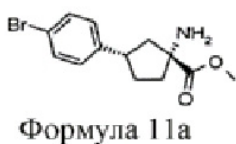
включающий в себя взаимодействие смеси соединений Формулы 10a и 10b



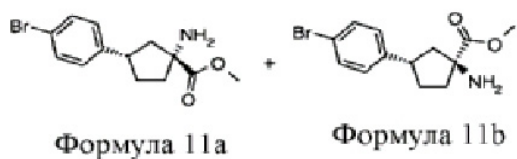
с тионилхлоридом и метанолом, по существу, до завершения реакции для образования смеси соединений Формулы 11a и 11b



12. Способ выделения соединения Формулы 11a



включающий в себя стадию фильтрования смеси соединений Формулы 11a и 11b



для выделения соединения Формулы 11a

