



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

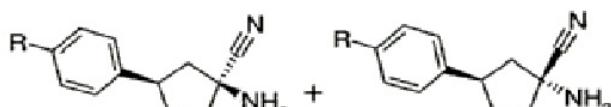
(43) Дата публикации заявки: 27.01.2011 Бюл. № 3

(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.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", А.В.Миць(71) Заявитель(и):
ЭББОТТ ЛЭБОРЭТРИЗ (US)(72) Автор(ы):
ГОРДОН Томас Д. (US),
УОЛЛЕЙС Грир 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 ФЕНИЛЦИКЛОПЕНТАНЭКАРБОКСИЛАТОВ

(57) Формула изобретения

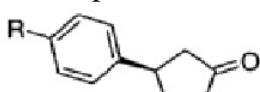
1. Способ для получения смеси соединения Формулы 2а и Формулы 2б,



2a

2b

содержащий стадию взаимодействия соединения формулы 1

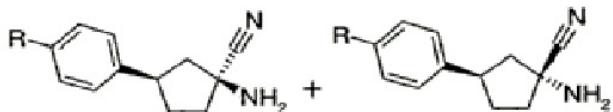


Формула 1

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

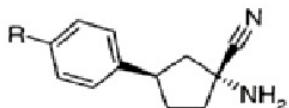
RU 2009128063 A

RU 2009128063 A

**2a****2b**

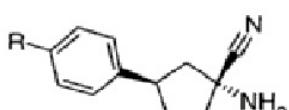
в которых R представляет собой Br или метокси.

2. Способ для выделения соединения Формулы 2b

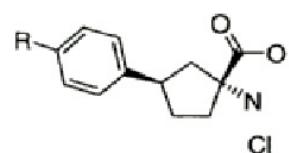
**Формула 2b**

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

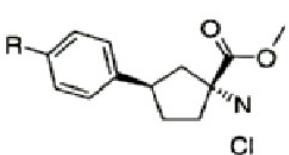
**Формула 2b**

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

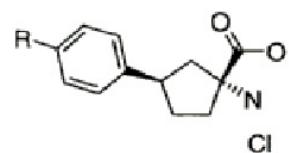
**Формула 3**

в которой R представляет собой Br или метокси.

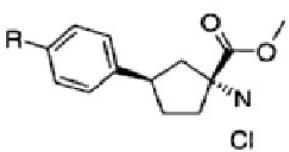
4. Способ для получения соединения Формулы 4

**Формула 4**

включающий в себя стадии взаимодействия соединения Формулы 3

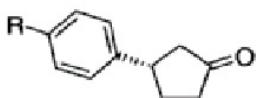
**Формула 3**

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

**Формула 4**

в которой R представляет собой Br или метокси.

5. Способ для получения соединения Формулы 5

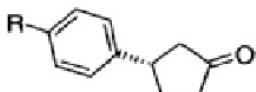


Формула 5

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



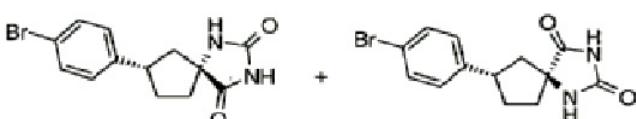
по существу, до завершения реакции для образования соединения Формулы 5



Формула 5

в которой R представляет собой Br или метокси.

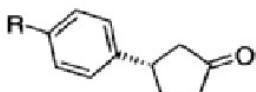
6. Способ для получения смеси соединений Формул ба и 6b,



Формула 6a

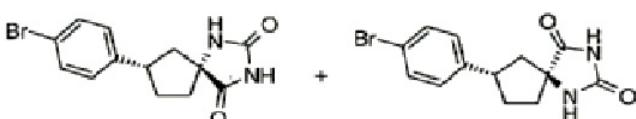
Формула 6b

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



Формула 5

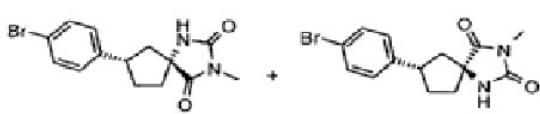
в которой R представляет собой Br, в основном, до завершения реакции, для образования смеси соединения Формул ба и 6b



Формула 6a

Формула 6b

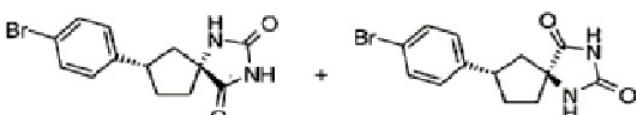
7. Способ для получения смеси соединений Формулы 7а и 7b



Формула 7a

Формула 7b

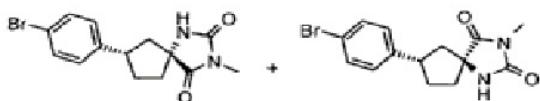
включающий в себя стадии взаимодействия смеси соединений формул ба и формуллы 6b



Формула 6a

Формула 6b

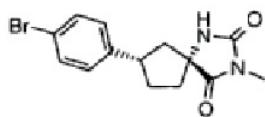
с карбонатом калия и алкилирующим веществом, по существу, до завершения реакции для получения смеси соединений Формулы 7а и 7b



Формула 7а

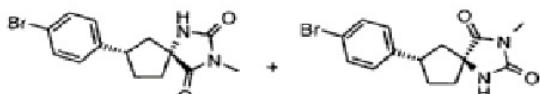
Формула 7б

8. Способ для выделения соединения Формулы 8



Формула 8

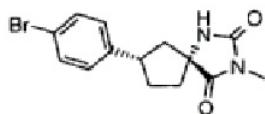
включающий в себя стадии растворения смеси соединений формулы 7а и формулы 7б



Формула 7а

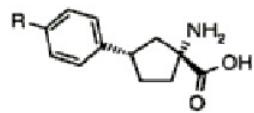
Формула 7б

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



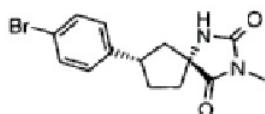
Формула 8

9. Способ для получения соединения Формулы 9



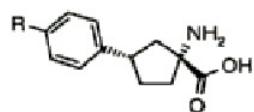
Формула 9

включающий в себя стадии гидролиза соединения Формулы 8



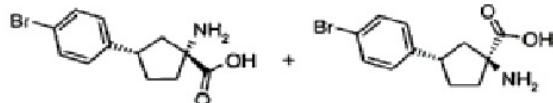
Формула 8

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



Формула 9

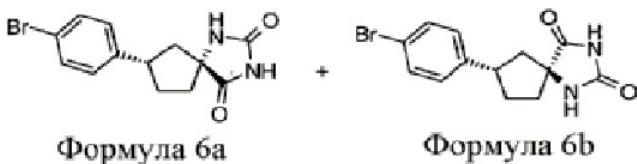
10. Способ для получения смеси соединений формуллы 10а и 10б



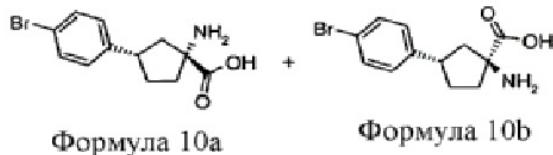
Формула 10а

Формула 10б

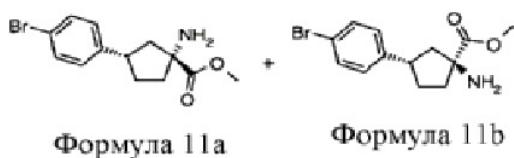
включающий в себя обработку смеси соединений формулы ба и бб



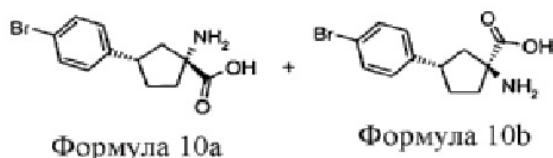
неорганической основой, по существу, до завершения реакции для образования смеси соединений формулы 10а и 10б



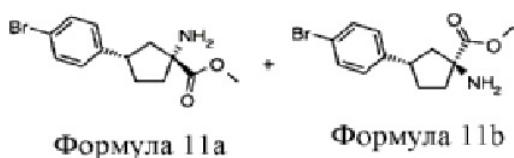
11. Способ для получения смеси соединений Формулы 11а и 11б



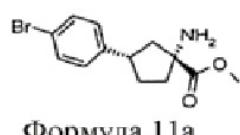
включающий в себя взаимодействие смеси соединений Формулы 10а и 10б



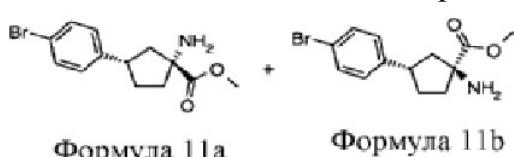
с тионилхлоридом и метанолом, по существу, до завершения реакции для образования смеси соединений Формулы 11а и 11б



12. Способ выделения соединения Формулы 11а



включающий в себя стадию фильтрования смеси соединений Формулы 11а и 11б



для выделения соединения Формулы 11а

