

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2015112195, 24.12.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
26.12.2012 IN 3359/MUM/2012

(43) Дата публикации заявки: 31.01.2017 Бюл. № 04

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 27.07.2015(86) Заявка РСТ:  
IN 2013/000801 (24.12.2013)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2014/102822 (03.07.2014)Адрес для переписки:  
197101, Санкт-Петербург, а/я 128, "АРС-  
ПАТЕНТ", К.В. Осипов

(71) Заявитель(и):

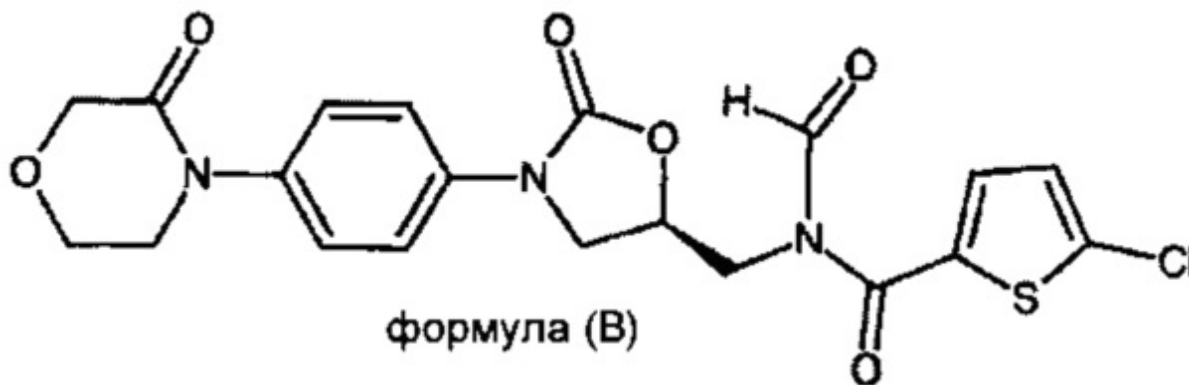
УЭНБЕРИ ЛТД. (IN)

(72) Автор(ы):

НИТИН Шарадчандра Прадан (IN),  
НИЛЕШ Судхир Патил (IN),  
РАДЖЕШ Рамчандра Валавалкар (IN),  
НИЛЕШ Субхас Кулкарни (IN),  
САНДИП Бабанрао Павар (IN),  
ТАРАК Самбаджи Павар (IN)(54) **АЛЬДЕГИДНОЕ ПРОИЗВОДНОЕ ЗАМЕЩЕННЫХ ОКСАЗОЛИДИНОВ**

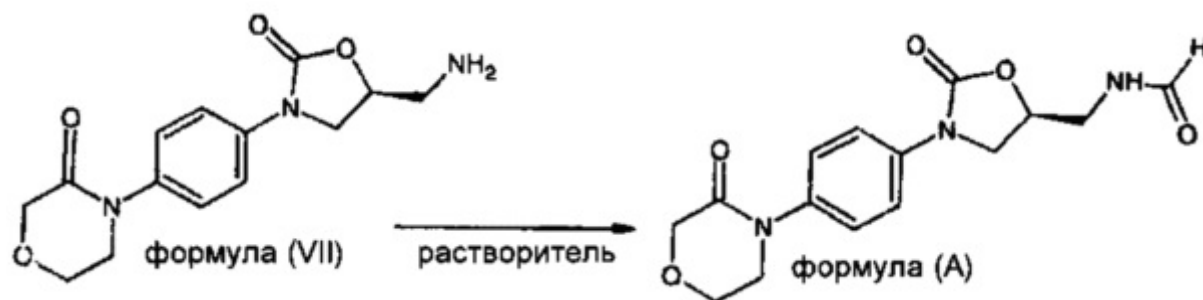
(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы (B)

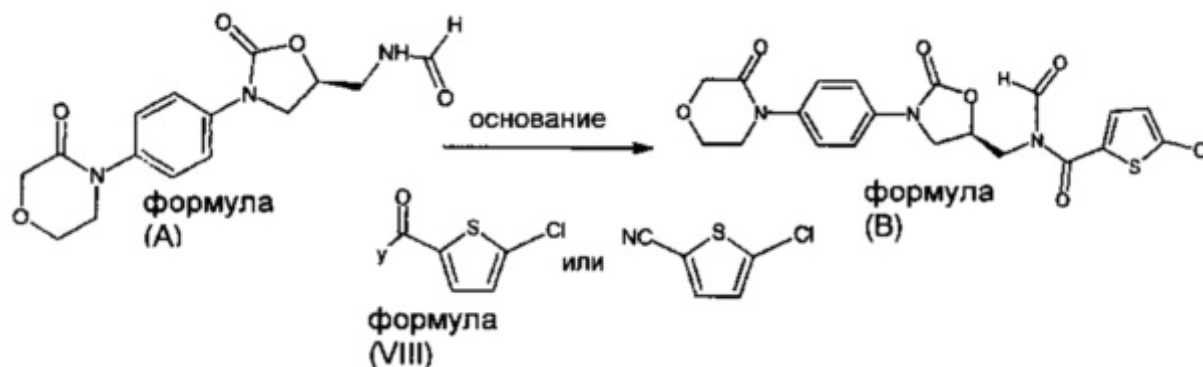


2. Способ получения соединения формулы (B) по п. 1, который включает

а) обработку соединения формулы (VII) органической кислотой в подходящем растворителе (растворителях) с образованием нового промежуточного продукта формулы (A), N-({(5S)-2-оксо-3-[4-(3-оксоморфолин-4-ил)фенил]-1,3-оксазолидин-5-ил} метил)формамида; и



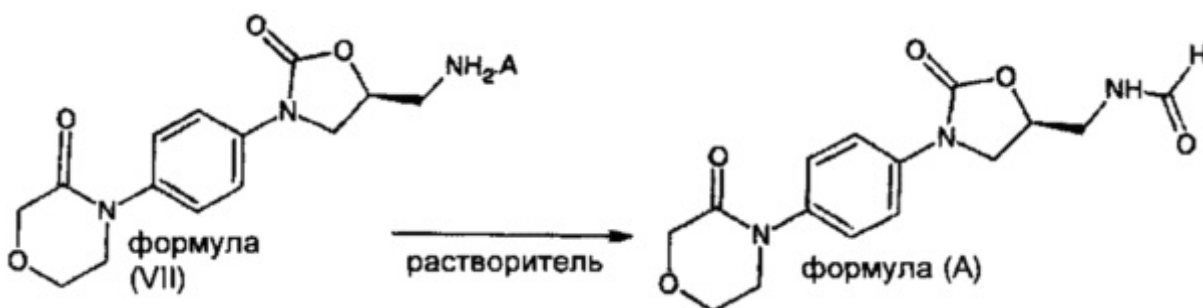
б) обработку соединения формулы (A) соединением формулы (VIII) или 5-хлортиофен-2-карбонитрилом в подходящем растворителе, выбранном среди дихлорметана, ацетона, толуола и простого эфира и их смесей, в присутствии основания для получения соединения формулы (B)



где Y представляет собой сульфонилокси, имидазол, триазол, тетразол, алкокси, замещенный алкокси, тригалогенметокси, N-гидроксисукцинамид, гидроксиль, сложный эфир, первичный амин, вторичный амин, п-нитрофенол, N-гидроксифталамид, N-гидроксibenзотриазол, хлор, фтор, бром и йод.

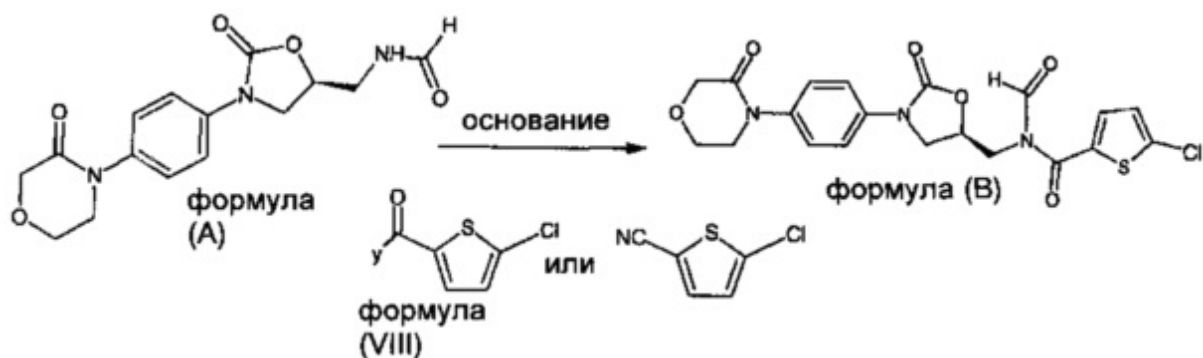
3. Способ получения соединения формулы (B) по п. 1, который включает

а) обработку кислотно-аддитивной соли соединения формулы (VII) основанием в подходящем растворителе (растворителях) с получением основания соединения формулы (VII), которое далее реагирует с органической кислотой в подходящем растворителе (растворителях) с образованием нового промежуточного продукта формулы (A), N-((5S)-2-оксо-3-[4-(3-оксоморфолин-4-ил)фенил]-1,3-оксазолидин-5-ил)метил)формамида;



A - кислотно-аддитивная соль.

б) обработку соединения формулы (A) соединением формулы (VIII) или 5-хлортиофен-2-карбонитрилом в подходящих растворителях, выбранных из дихлорметана, ацетона, толуола и простого эфира и их смесей, в присутствии основания для получения соединения формулы (B)



где Y представляет собой сульфонилокси, имидазол, триазол, тетразол, алкокси, замещенный алкокси, тригалогенметокси, N-гидроксисукцинамид, гидроксильный, сложный эфир, первичный амин, вторичный амин, п-нитрофенол, N-гидроксифаламид, N-гидроксибензотриазол, хлор, фтор, бром и йод.

4. Способ по п. 2, где органическая кислота является одной или более чем одной из карбоновых кислот, выбранных из группы, состоящей из муравьиной кислоты, щавелевой кислоты и янтарной кислоты.

5. Способ по п. 2, где соединение формулы (B) очищают, комбинируя один или более чем один из процессов отмывки, осаждения, фильтрации, сушки и/или дистилляции.

6. Фармацевтическая композиция, содержащая соединение формулы (B) по п. 1 в сочетании с подходящими фармацевтически приемлемыми эксципиентами.

7. Лекарственное средство для лечения или профилактики тромбоэмболических заболеваний у человека и животных, содержащее соединение формулы (B) по п. 1.

8. Антикоагулянт, содержащий соединение формулы (B) по п. 1.

9. Способ по п. 3, где органическая кислота является одной или более чем одной из карбоновых кислот, выбранных из группы, состоящей из муравьиной кислоты, щавелевой кислоты и янтарной кислоты.

10. Способ по п. 3, где соединение формулы (B) очищают, комбинируя один или более чем один из процессов отмывки, осаждения, фильтрации, сушки и/или дистилляции.