



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 933433
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5
C 07D 307/77
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 02.08.93
(24) Alkupäivä - Löpdag 02.08.93
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 04.02.94
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
03.08.92 EP 92113190 P

(71) Hakija - Sökande

1. Societe des Produits Nestle S.A., Vevey, Switzerland, (CH)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Huynh-Ba, Tuong, 5b, Chemin de Leisis, 1009 Pully, Switzerland, (CH)

(74) Asiamies - Ombud: Leitzinger Oy

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Kviinihapon 3- ja/tai 4-substituoidut johdokset ja menetelmä niiden valmistamiseksi
3- och/eller 4-substituerade derivat av quinsyra och förfarande för deras framställning

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksinnön kohteena on 3- ja/tai 4-substituoidut heksahydro-1,3,4,5-tetrahydroksibentsoehappojohdannaiset ja menetelmä valmistaa 3- ja/tai 4-substituoituja heksahydro-1,3,4,5-tetrahydroksibentsoehappojohdannaisia. Heksahydro-1,3,4,5-tetrahydroksibentsoehapon 3- tai 4-mono- tai 1,3- tai 1,4- tai jopa 3,4-disubstituoituja johdannaisia valmistetaan reaktiolla hydroksikanelihappojohdannaisen kanssa, jonka fenoliryhmä(t) on suojattu heksahydro-1,3,4,5-tetrahydroksibentsoehappojohdannaisella esterin muodostamiseksi ja 3- ja 4-asemissa olevien OH-funktioiden erilaisia reaktiokykyjä käytetään esteröinnin suorittamiseksi selektiivisesti alhaisissa lämpötilaolosuhteissa, minkä jälkeen suojaryhmät poistetaan kontrolloiduissa happo- ja lämpötilaolosuhteissa. Nämä olosuhteet välttävät kaiken hajoamisen ja isomerisoinnin. Menetelmä mahdollistaa saatujen uusien kinidiin saamisen korkeilla saannoilla.

Uppfinningen avser 3- och/eller 4-substituerade hexahydro-1,3,4,5-tetrahydroksibensoesyra-derivat och förfarande för framställning av 3- och/eller 4-substituerade hexahydro-1,3,4,5-tetrahydroksibensoesyra-derivat. Hexahydro-1,3,4,5-tetrahydroksibensoesyran 3- eller 4-mono- eller 1,3- eller 1,4- eller t.o.m. 3,4-disubstituerade derivat framställs genom reaktion med hydroksikanelisyra-derivat, vars fenolgrupp(er) är skyddade med ett hexahydro-1,3,4,5-tetrahydroksibensoesyra-derivat för att bilda en ester och OH-funktioner i 3- och 4-ställningar olika reaktiviteter används för att utföra förestringen selektivt vid låg temperatur, varefter skyddsgrupperna avlägsnas vid kontrollerade syra- och temperaturförhållanden. Dessa förhållanden undviker all sönderfall och isomerisering. Förfarandet möjliggör att de erhållna kiniderna med erhålls med ett högt utbyte.