



AMRI®



PUBLICATIONS PATENTS PRESENTATIONS

Volume 2

July 2001 - October 2007



NORGE

(12) PATENT

(19) NO

(11) 311717

(13) B1

(51) Int Cl⁷ C 07 D 211/14

Patentstyret

(21) Søknadsnr	19982770	(86) Int. inng. dag og søknadsnummer	1996.12.19, PCT/US96/20189
(22) Inng. dag	1998.06.16	(85) Videreføringssdag	1998.06.16
(24) Løpedit	1998.12.19	(30) Prioritet	1995.12.21, US, 576068
(41) Alm. tilgj.	1998.06.16		
(45) Meddelt dato	2002.01.14		
(71) Patenthaver	Albany Molecular Research Inc, 21 Corporate Circle, Albany, NY 12203-0289, US		
(72) Oppfinner	Thomas E. D'Ambr, Wyantskill, NY, US Garry M. Pilling, East Nassau, NY, US		
(74) Fullmektig	Onsagers AS, 0103 Oslo		
(54) Benevnelse	Fremgangsmåte for fremstilling av piperidinderivat		
(56) Anførte publikasjoner	NO A 955023 J. MARCH, 3. ED., ADV. ORG. CHEM., S. 425-426		

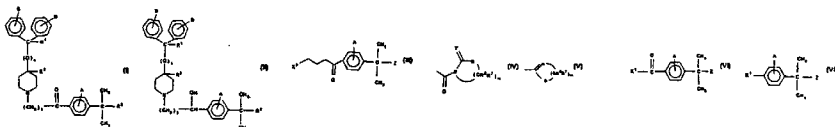
(57) Sammendrag

Det er beskrevet en fremgangsmåte for fremstilling av piperidinderivatforbindelser av formelene (I, II), hvor n er 0 eller 1; R¹ er hydrogen eller hydroksy; R² er hydrogen; eller, når n er 0, danner R¹ og R² sammen en andre binding mellom karbonatomene som bærer R¹ og R², forutsatt at når n er 1, er R¹ og R² begge hydrogen; R³ er -COOH eller -COOR³; R⁴ er en alkyl- eller arylenhet; A, B og D er substituentene på ringene, som kan være like eller forskjellige, og er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, halogener, alkyl, hydroksy, alkoksy og andre substituent. Fremgangsmåten innbefatter tilveiebringelse av en regioisomer av formel (III), hvor Z er -CG⁴G⁵G⁶ (IV) eller (V), m er et helt tall fra 1 til 6; Q og Y er like eller forskjellige og er valgt fra gruppen bestående av O, S og NR⁷; G¹, G² og G³ er like eller forskjellige og er valgt fra gruppen bestående av OR⁸, SR⁸ og NR⁸R⁹; R⁶ og R⁷ er like eller forskjellige og er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, en alkylenhet, en arylenhet, OR⁸, SR⁸ og NR⁸R⁹; og R⁹, R⁸ og R⁷ er like eller forskjellige og er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, en alkylenhet og en arylenhet og omdanning av regioisomeren til piperidinderivatforbindelsen med en piperidinforbindelse.


NORGE
(12) PATENT
(19) NO
(11) 311718
(13) B1
(51) Int Cl⁷ C 07 D 211/14, A 61 K 31/445
Patentstyret

(21) Søknadsnr	19982806	(86) Int. inng. dag og søknadsnummer	1996.12.19. PCT/US96/20769
(22) Inng. dag	1998.06.18	(85) Videreføringsdag	1998.06.18
(24) Løpedag	1996.12.19	(30) Prioritet	1995.12.21. US. 575344
(41) Alm. tilgj.	1998.08.12		
(45) Meddelt dato	2002.01.14		

(71) Patenthaver	Albany Molecular Research Inc, 21 Corporate Circle, Albany, NY 12203-0289, US
(72) Oppfinner	Thomas E. D'Ambra, Wyantskill, NY, US Garry M. Pilling, East Nassau, NY, US
(74) Fullmektig	Onsagers AS, 0103 Oslo

(54) Benevnelse Fremgangsmåte for fremstilling av piperidinderivat
**(56) Anførte publikasjoner NO A 955255
J. MARCH, 3. ED., ADV. ORG. CHEM., S. 425-426**
(57) Sammendrag


Det er beskrevet fremgangsmåter for fremstilling av piperidinderivatforbindelser av formelene (I) eller (II), hvor n er 0 eller 1; R¹ er hydrogen eller hydroksty; R² er hydrogen; eller, når n er 0, danner R¹ og R² sammen en andre binding mellom karbonatomene som bærer R¹ og R², forutsatt at når n er 1, er R¹ og R² begge hydrogen; R³ er -COOH eller -COOR⁴; R⁴ er en alkyl- eller arylenhet; A, B og D er substituerter på ringene, som kan være like eller forskjellige er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, halogener, alkyl, hydroksty, alkoksy og andre substituerter. En fremgangsmåte innbefatter tilveiebringelse av en regioisomer av formel (III) hvor X er -CG¹G²G³, (IV) eller (V), m er et helt tall fra 1 til 6; Q og Y er like eller forskjellige er valgt fra gruppen bestående av O, S og NR⁵; G¹, G² og G³ er like eller forskjellige er valgt fra gruppen bestående av OR⁶, SR⁶ og NR⁶R⁶; X¹ er halogen, OR⁷, SR⁷, NR⁷R⁷, OSO₂R⁷ eller NHSO₂R⁷; R⁶ og R⁷ er like eller forskjellige og er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, en alkyl-enhet, en arylenhet, OR⁸, SR⁸ og NR⁸R⁸; og R⁵, R⁸, R⁹, R¹⁵ og R¹⁶ er like eller forskjellige og er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, en alkyl-enhet og en arylenhet; og omdanning av regioisomeren til piperidinderivatforbindelsen med en piperidinforbindelse. En annen fremgangsmåte for fremstilling av piperidinderivatforbindelsene omfatter tilveiebringelse av α,α-disubstituert-metylbenzenderivat som har formelen (VI) hvor X¹ er et halogen, trialkyl- eller triaryltinn, trialkyl- eller triarylbordat, trialkylsilisium, alkylhalogensilisium, en substituert sulfonsyreester eller substituerter som er nyttige i organometaliske koblingsreaksjoner og omdanning av det α,α-disubstituerte-metylbenzenderivatet til piperidinderivatforbindelsen med en piperidinforbindelse. I nok en annen fremgangsmåte tilveiebringes et 4-(α,α-disubstituert)-toluensyrederivat som har formelen (VII) hvor X² er et halogen; et alkalimetalloksyd; en enhet som har formelen -OR¹⁰, en enhet som har formelen -SR¹⁰; eller et amin; og R¹⁰ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, en alkylenhet og en arylenhet, og denne omdannes til piperidinderivatforbindelsen med en piperidinforbindelse.



USA

HUNGARY



INDIA

SINGAPORE



AMRI[®]

amriglobal.com