

(19)



REPUBLIKA SLOVENIJA
MINISTRSTVO ZA GOSPODARSKI RAZVOJ IN TEHNOLOGIJO
URAD RS ZA INTELEKTUALNO LASTNINO

(10) **SI/EP 2571843 T1**

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **201131394**

(51) Int. Cl. (2018.01)

(22) Datum prijave: **16.05.2011**

C07C 67/00

C07C 319/00

C07C 45/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:

30.04.2018

(96) Evropska patentna prijava:

16.05.2011 EP 11720091.5

(30) Prednostna pravica:

17.05.2010 EP 10305519

(87) Objava mednarodne patentne prijave:

WO 2011/144579, 24.11.2011

(86) Mednarodna patentna prijava:

16.05.2011 WO PCT/EP2011/057903

(97) Objava evropskega patenta:

EP 2571843 B1, 27.12.2017

(72) Izumitelji: **BERTRAND Karine, F-59236 Frelinghien, FR;**

ROUDOT Alice, F-59160 Lomme, FR;

ROOL Patrice, F-91800 Brunoy, FR

(73) Imetnik: **GENFIT Parc Eurasante - Lille Metropole,**

885, avenue Eugene Avinee, 59120 Loos, FR

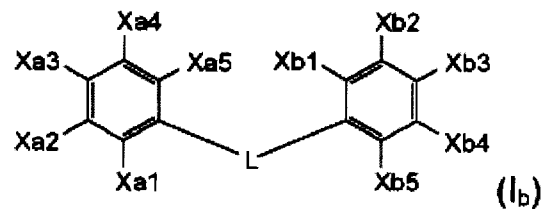
(74) Zastopnik: **ZIVKO MIJATOVIC & PARTNERS, d.o.o., Ulica stare pravde 10, 1000 Ljubljana, SI**

(54) **IZBOLJŠANA PRIPRAVA KALKONSKIH DERIVATOV**

SI/EP 2571843 T1

IZBOLJŠANA PRIPRAVA KALKONSKIH DERIVATOV
PATENTNI ZAHTEVKI

1. Metoda za pripravo spojine s splošno formulo (I_b):



pri čemer

X_{a1} , X_{a2} , X_{a3} , X_{a4} , and X_{a5} , identični ali različni, so vodikov atom atom, atom halogena,

R_a or G_a-R_a skupina;

R_a je alkil, alkenil, cikloalkil, aril, alkiloksi, alkiltio, ali heterociklična skupina, omenjena skupina je lahko substituirana ali ne, ali R_a je zaščitna skupina vezana na fenilni obroč s kisikovim atomom ali žveplovim atomom;

L je CO- R_L ali R_L -CO skupina;

X_{b1} , X_{b2} , X_{b3} , X_{b4} , and X_{b5} so substituentne skupine, pri čemer je ena od njih $R'_b-G_b-R_c$ ali G_b-R_c skupina, in je vsaj ena od drugih substituentnih skupin sosednjih omenjeni $R'_b-G_b-R_c$ ali G_b-R_c skupini atom halogena ali



R''_b skupina, ostale skupine so neodvisno vodikovi atomi, atomi halogena ali R''_b skupine;

R''_b je alkil, alkenil, cikloalkil, aril, alkoksi, alkiltio, ali heterociklična skupina, omenjena skupina je lahko substituirana ali ne, ali R''_b je zaščitna skupina vezana na fenilni obroč s kisikovim atomom ali atomom žvepla;

R'_b je alkil, alkenil, cikloalkil, aril, alkiloksi, alkiltio, ali heterociklična skupina, omenjena skupina je lahko substituirana ali ne;

R_L nesubstituirana ali substituirana alkil ali alkenil skupina;

G_a je kisikov atom ali atom žvepla;

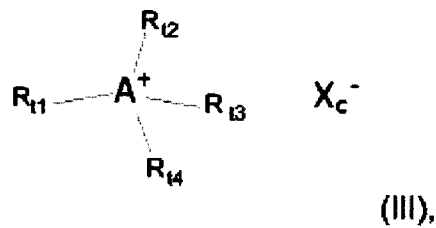
G_b je kisikov atom;

R_c je alkilna skupina, substituirana z vsaj eno $-COOR_d$ skupino, kjer je R_d nesubstituirana alkil, alkenil, aril, cikloalkil ali heterociklična skupina;

omenjena metoda obsega naslednje korake:

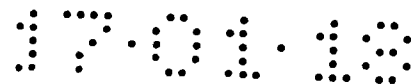
a) pridobivanje spojine s splošno formulo (I_a), v kateri so X_{a1} , X_{a2} , X_{a3} , X_{a4} , X_{a5} , L, R_a , R'_b , R''_b , R_L , G_a , in skupina G_b definirani kot za splošno formulo (I_b); in X_{b1} , X_{b2} , X_{b3} , X_{b4} in X_{b5} so substituentne skupine kjer je ena izmed njih R'_b-G_b-H ali G_b-H skupina, in je vsaj ena od substituentnih skupin, sosednjih omenjeni R'_b-G_b-H ali G_b-H skupini halogen ali R''_b skupina, ostale skupine so neodvisno vodikovi atomi, atomi halogena ali R''_b skupin;

b) kontaktiranje spojine s splošno formulo (I_a) z derivatom sulfonske kisline s splošno formulo (II) $R_s-SO_2-O-R_c$, v dvofaznem mediju organsko topilo / voda in v prisotnosti spojine s splošno Formulo (III):



v kateri:

- R_s , R_{t1} , R_{t2} , R_{t3} , in R_{t4} , identični ali različni, so nesubstituirane skupine;
 - A je dušikov ali atom forforja;
 - X_c halogen, HSO_4 , ali H_2PO_4 ; in
 - R_c je definiran kot po splošni formuli (I_b).
2. Metoda po zahtevku 1, kjer je skupina R_L nesubstituirana alkilna ali alkenilna skupina, ki ima od dva do sedem ogljikovih atomov ali, natančneje, skupina L je $CO-CH=CH$, $CO-CH_2-CH_2$, $CH=CH-CO$ ali CH_2-CH_2-CO .
 3. Metoda po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, kjer je ena izmed substituentnih skupin med X_{a1} , X_{a2} , X_{a3} , X_{a4} in X_{a5} , s splošno formulo (I_a) in (I_b) in še posebej X_{a3} halogen, R_a ali G_a-R_a skupina in druge štiri substituentne skupine med X_{a1} , X_{a2} , X_{a3} , X_{a4} in X_{a5} so atomi vodika.
 4. Metoda po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, kjer je substituentna skupina X_b s splošno formulo (I_a), ki po koraku (b) postane skupina G_b-R_c , skupina G_b-H .
 5. Metoda po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, kjer spojine s splošno formulo (I_a) in (I_b) predstavljajo posamezno R_a ali G_a-R_a skupino.



6. Metoda po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, kjer je substituentna skupina X_b s splošno formulo (I_a), ki je R'_b - G_b -H ali G_b -H skupina X_{b1} ali X_{b3} .
7. Metoda po katerem koli od predhodnih zahtevkov, kjer sta vsaj dve izmed X_{b1} , X_{b2} , X_{b3} , X_{b4} in X_{b5} s splošno Formulo (I_a) in (I_b), ki niso R'_b - G_b -H ali G_b -H skupina, halogen ali R''_b skupina, ena ki je X_b sosednja X_b , ki je R'_b - G_b -H ali G_b -H skupina, in ostala substituentna skupina(e), ki je(so) atom(i) vodika.
8. Metoda po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, kjer skupine X_b , ki niso niti R'_b - G_b -H ali G_b -H skupine, niti atom vodika, so enake ali različne R''_b skupinam, ki so nesubstituirane alkilne skupine ali alkiloksi skupine.
9. Metoda po zahtevku 8, kjer so omenjene X_b skupine X_{b2} in X_{b4} .
10. Metoda po katerem koli od predhodnih zahtevkov, kjer spojine s splošno formulo (I_b) obsegajo R_c in R_d ki so enake ali različne alkilnim skupinam z enim do sedmimi atomi ogljika.
11. Metoda po katerem koli izmed predhodnih zahtevkov, kjer je derivat sulfonske kisline s splošno formulo (II) mezilat skupine R_c .
12. Metoda po katerem koli izmed predhodnih zahtevkov, kjer je spojina s splošno formulo (III) s formulo (III) kjer je A je atom dušika.

13. Metoda po katerem koli od predhodnih zahtevkov, kjer spojino s splošno formulo (I_b) nadalje modificiramo z uporabo hidrolizo, reakcijami redukcije ali epoksidacije.
14. Metoda po zahtevku 13, kjer je spojina, ki jo je treba modificirati, s splošno formulo (I_b), kjer je L CO-CH=CH skupina; X_{a1}, X_{a2}, X_{a4}, X_{a5}, X_{b1} in X_{b5} so H; X_{a3} je halogen, R_a ali G_a-R_a skupina; X_{b2} in X_{b4}, identični ali različni, so halogen ali R["]_b skupina, X_{b3} je G_b - R_c skupina, kot je definirano v zahtevku 1.