(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

(43) Date de la publication internationale
8 juillet 2010 (08.07.2010)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2010/076474 A1

(51) Classification internationale des brevets :
C07D 207/46 (2006.01) *C07D 401/12* (2006.01)
C07D 213/71 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2009/052528

(22) Date de dépôt international :
15 décembre 2009 (15.12.2009)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
08/07090 17 décembre 2008 (17.12.2008) FR

(71) Déposant *(pour tous les États désignés sauf US)* : **SANOFI-AVENTIS** [FR/FR]; 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(72) Inventeur; et

(75) Inventeur/Déposant *(pour US seulement)* : **BIGOT, Antony** [FR/FR]; c/o sanofi-aventis, Département Brevets, 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

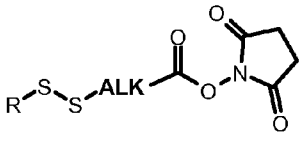
(74) Mandataire : **SENNINGER, Thierry**; c/o sanofi-aventis, Département Brevets, 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(81) États désignés *(sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible)* : AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD,

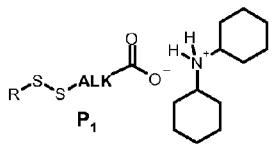
[Suite sur la page suivante]

(54) **Title** : METHOD FOR PREPARING ACTIVATED ESTERS

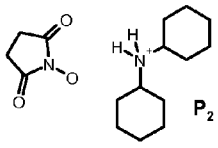
(54) **Titre** : PROCEDE DE PREPARATION D'ESTERS ACTIVES



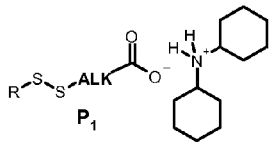
(I)



P_1



P_2



P_1

(57) **Abstract** : The invention relates to a method for preparing an activated ester of the formula (I), where R is a (C_1-C_6) alkyl, aryl, heteroaryl, cycloalkyl, or heterocycloalkyl group, and ALK is a (C_1-C_6) alkylene group, said method consisting of reacting the dicyclohexylamine P_1 salt and the disuccinimidyl carbonate (DSC) in a solvent in which the dicyclohexylamine salt of the N-hydroxysuccinimide P_2 is precipitated. The invention also relates to products of the formula P_1.

(57) **Abrégé** : L'invention est relative à un procédé de préparation d'un ester activé de formule (I) dans laquelle R représente un groupe (C_1-C_6) alkyle, aryle, hétéroaryle, cycloalkyle, hétérocycloalkyle et Alk représente un groupe (C_1-C_6) alkylène, consistant à faire réagir le sel de dicyclohexylamine P_1 : et le carbonate de disuccinimidyl e (DSC) dans un solvant dans lequel le sel dicyclohexylamine de la N-hydroxysuccinimide P_2 précipite. L'invention est aussi relative aux produits de formule P_1 :

WO 2010/076474 A1

SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) **États désignés** *(sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible)* : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

— *avec rapport de recherche internationale (Art. 21(3))*