

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International patent classification⁶: C07B 57/00, C07C 319/28, 323/56	A1	(11) International publication number: WO 98/49124 [stamp] (43) International publication date: 5 November 1998 (05.11.98)
(21) International application number: PCT/EP98/02176 (22) International filing date: 14 April 1998 (14.04.98) (30) Data relating to the priority: 197 17 429.9 25 April 1997 (25.04.97) DE (71) Applicant (for all designated States except US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (US only): PREISS, Michael [DE/DE]; Paul-Ehrlich-Strasse 12, D-42113 Wuppertal (DE). (74) Joint Representative: BAYER AKTIENGESELL- SCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).		(81) Designated states: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, GW, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published With the International Search Report.

As printed

(54) Title: PRODUCTION OF ENANTIOMER-FREE BIARYLKETOCARBOXYLIC ACIDS**(54) Bezeichnung:** HERSTELLUNG ENANTIOMERENREINER BIARYLKETOCARBONSÄUREN**(57) Abstract**

The invention relates to a novel method for producing enantiomer-free biarylketocarboxylic acids, whereby S-phenylethylamine is used as an auxiliary base in racemate resolution. Biarylketocarboxylic acids, specially substituted biaryl-4-ketocarboxylic acids, are inhibitors for enzymes of the matrix-metallo-proteinase class. Osteoarthritis, rheumatoid arthritis and metastases can, for instance, be combated by inhibiting the above-mentioned enzymes.

(57) Zusammenfassung

Gegenstand der Erfindung ist ein fortschrittliches Verfahren zur Herstellung enantiomerenreiner Biarylketocarbonsäuren, wobei als Hilfsbase bei der Racematspaltung S-Phenylethylamin eingesetzt wird. Biarylketocarbonsäuren, im besonderen substituierte Biaryl-4-ketocarbonsäuren, sind Inhibitoren für Enzyme der Klasse der Matrix-Metallo-Proteinasen. Durch Inhibition der obengenannten Enzyme können z.B. Osteoarthritis, rheumatoide Arthritis und Metastasen bekämpft werden.