

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
16. Juni 2005 (16.06.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/054195 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 209/46**,
C07C 233/66

GOURAUD, Yves [FR/FR]; 87 Avenue des Pervenches,
F-93370 Montfermeil (FR).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/013153

(22) Internationales Anmeldedatum:
19. November 2004 (19.11.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 56 717.8 2. Dezember 2003 (02.12.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **AVENTIS PHARMA DEUTSCHLAND
GMBH** [DE/DE]; Brüningstrasse 50, 95929 Frankfurt
(DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **SCHUBERT, Gerrit**
[DE/DE]; Feldbergstrasse 2a, 65779 Kelkheim (DE).
RIEKE-ZAPP, Joerg [DE/DE]; Arndtstrasse 50, 60325
Frankfurt (DE). **KEIL, Johannes** [DE/DE]; Johannesallee
12, 65929 Frankfurt (DE). **KLEEMANN, Heinz-Werner**
[DE/DE]; Mainstrasse 29, 65474 Bischofsheim (DE).
HANNA, Reda [US/US]; 1043 Treeline Drive, Allentown,
PA 18103 (US). **HUANG, Bao-Guo** [CN/US]; 10 Shields
Lane, Bridgewater, NJ 08807 (US). **WU, Xiao-Dong**
[US/US]; 58 Bond St., Bridgewater, NJ 08807 (US).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

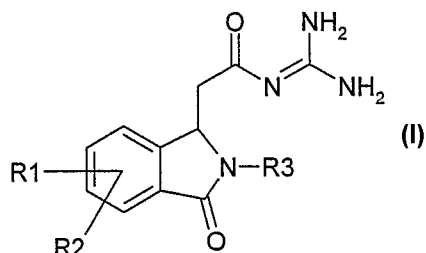
Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING (3-OXO-2,3-DIHYDRO-1H-ISOINDOL-1-YL) ACETYLGUANIDINE DERIVA-
TIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON (3-OXO-2,3-DIHYDRO-1H-ISOINDOL-1-YI)-ACETYL-GUA-
NIDIN-DERIVATEN



(57) Abstract: The invention relates to methods for producing (3-oxo-2,3-dihydro-1H-isoindol-1-yl) acetylguanidine derivatives of formula (I) using 3-hydroxy-2,3-dihydro-1H-isoindol-1-one derivatives or 3-(2-carbamoyl-phenyl) acrylic acid ester derivatives as intermediate stages, to a method for the resolution of racemates and to intermediate products of the inventive method.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Verfahren zur Herstellung von (3-Oxo-2,3-dihydro-1H-isoindol-1-yl)-acetylguanidin-Derivaten der Formel (I) über 3-Hydroxy-2,3-dihydro-1H-isoindol-1-on-Derivate oder 3-(2-Carbamoyl-phenyl)-acrylsäureester-Derivate als Zwischenstufen, ein

Verfahren zur Racematspaltung, sowie Zwischenprodukte der erfindungsgemässen Verfahren.

WO 2005/054195 A1