

2006078539

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

162162

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
1. Dezember 2005 (01.12.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/113496 A1(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 205/08

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/005498

(22) Internationales Anmeldedatum:
20. Mai 2005 (20.05.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 025 071.5 21. Mai 2004 (21.05.2004) DE
10 2005 010 770.2 9. März 2005 (09.03.2005) DE(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): AVENTIS PHARMA DEUTSCHLANDGMBH [DE/DE]; Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt am
Main (DE).

13 NOV 2006

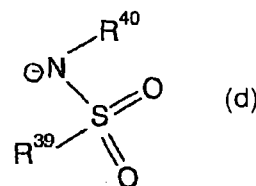
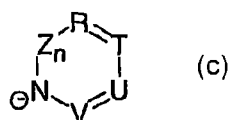
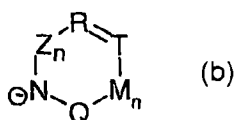
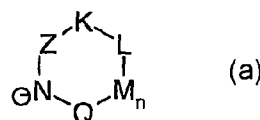
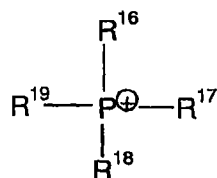
(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): LINDENSCHMIDT,
Andreas [DE/DE]; Brahmsstr. 4, 65812 Bad Soden
(DE). WILL, David, William [GB/DE]; Kirchstrasse
21, 65830 Krißel (DE). JAEHNE, Gerhard [DE/DE];
Seebachstrasse 22, 65929 Frankfurt (DE). WOLL-
MANN, Theodor, Andreas [DE/DE]; Im Heideck 11,
65796 Hattersheim (DE). FRICK, Wendelin [DE/DE];
Schornmühlstrasse 3, 65510 Hünstetten-Beuerbach (DE).
JUNKER, Bernd [DE/DE]; Joseph-Haydn-Strasse
32, 65812 Bad Soden (DE). RIGAL, David [FR/DE];
Paul-Duden-Strasse 29, 65830 Krißel (DE). BILLEN,
Guenter [DE/DE]; Goethestrasse 6, 65527 Niederrhausen

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING 1,4-DIPHENYL AZETIDINONE DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 1,4-DIPHENYLAZETIDINON-DERIVATEN



(57) Abstract: The invention relates to a method for producing 1,4-diphenyl azetidinone derivatives from suitably protected β -substituted amino amides, in the presence of silylation agents. Said method uses cyclization catalysts that comprise phosphonium ions as the cation of formula (XII), and ions of the following general formulas (a), (b), (c) or (d) as the anion. In said formulas, the symbols, substituents and indices are defined as follows: Z = C=O, C=S, S=O, SO₂ or C=NR²⁰; K = O, S, NR²¹ or CR²²R²³; L = NR²⁴ or CR²⁵R²⁶; n = 0 or 1; M = O, C=O, NR²⁷ or CR²⁸R²⁹; Q = O, S, NR³⁰, CR³¹R³², C=O, C=S, S=O, SO₂ or C=NR³⁴; R = CR³⁵ or N; T = CR³⁶ or N; U = CR³⁷ or N; V = CR³⁸ or N; the groups R¹⁶ to R¹⁹ can represent, for example, aryl or (C₁-C₁₅) alkyl, aryl(C₁-C₁₀) alkene, and the groups R²⁰ to R³² and R³⁴ to R³⁸ can represent in addition H or heteroaryl; R³⁹ and R⁴⁰ represent, for example (C₁-C₆) alkyl. The anion can also be R⁴¹O⁻, R⁴²COO⁻ or Cl⁻, Br⁻ or I⁻ (combined with Ag₂O).

(57) Zusammenfassung: In dem Verfahren zur Herstellung von 1,4-Diphenylazetidinon-Derivaten aus in geeigneter Weise geschützten β -substituierten Aminoamiden in Gegenwart von Silylierungsmitteln werden Zyklisierungskatalysatoren eingesetzt, die als Kation (XII), Phosphoniumionen und als Anion solche der nachfolgenden allgemeinen Formeln (a) oder (b) oder (c) oder (d) aufweisen, wobei die Symbole, Substituenten und Indices folgende Bedeutung haben: Z = C=O, C=S, S=O, SO₂ oder C=NR²⁰; K = O, S, NR²¹ oder CR²²R²³; L = NR²⁴ oder CR²⁵R²⁶; n = 0 oder 1; M = O, C=O, NR²⁷ oder CR²⁸R²⁹; Q = O, S, NR³⁰, CR³¹R³², C=O, C=S, S=O, SO₂ oder C=NR³⁴; R = CR³⁵ oder N; T = CR³⁶ oder N; U = CR³⁷ oder N; V = CR³⁸ oder N; und die angeführten Reste R¹⁶ bis R¹⁹ zum Beispiel Aryl oder (C₁-C₁₅) Alkyl, Aryl-(C₁-C₁₀) Alkyl, und die Reste R²⁰ bis R³² und R³⁴ bis R³⁸ zusätzlich auch H oder Heteroaryl bedeuten können; R³⁹ und R⁴⁰ sind zum Beispiel (C₁-C₆) Alkyl. Das Anion kann auch R⁴¹O⁻, R⁴²COO⁻ oder Cl⁻, Br⁻ oder I⁻ (kombiniert mit Ag₂O) sein.

WO 2005/113496 A1



ACTION