

(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
22. April 2021 (22.04.2021)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2021/074078 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 471/04 (2006.01) C07C 59/255 (2006.01)
C07B 57/00 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2020/078613

(22) Internationales Anmeldedatum:
12. Oktober 2020 (12.10.2020)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
19203825.5 17. Oktober 2019 (17.10.2019) EP

(71) Anmelder: **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT**
[DE/DE]; Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen
(DE).

(72) Erfinder: **PLATZEK, Johannes**; Grottkauer Str. 55,
12621 Berlin (DE). **LOVIS, Kai**; Jahnstr. 109A, 40215
Düsseldorf (DE).

(74) Anwalt: **BIP PATENTS**; Alfred-Nobel-Str. 10, 40789
Monheim am Rhein NRW (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY,
BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM,
DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH,
KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA,

MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI,
NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU,
RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST,
SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ,
RU, TJ, TM), europäisches (AL, 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, RS, SE, SI,
SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz
3)

(54) Title: PROCESS FOR THE PREPARATION OF 2-CYANOETHYL (4S)-4-(4-CYANO-2-METHOXY-PHENYL)-5-ETHOXY-2,8-DIMETHYL-1,4-DIHYDRO-1,6-NAPHTHYRIDINE-3-CARBOXYLATE BY RESOLUTION OF RACEMATES BY MEANS OF DIASTEREOMERIC TARTARIC ACID ESTERS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 2-CYANOETHYL (4S)-4-(4-CYANO-2-METHOXY-PHENYL)-5-ETHOXY-2,8-DIMETHYL-1,4-DIHYDRO-1,6-NAPHTHYRIDINE-3-CARBOXYLAT DURCH RACEMAT-SPALTUNG MITTELS DIASTEREOMERER WEINSÄUREESTER

(57) Abstract: The present invention relates to the diastereomer salts (Va), (Vb), (Vc) and/or (Vd), a process for preparing the diastereomer salts (Va), (Vb), (Vc) and/or (Vd) using a chiral-substituted tartaric acid ester of the formula (IIIa) or (IIIb), a process for preparing the compound according to formula (IVa) using the diastereomer salts (Va), (Vb), (Vc) and/or (Vd), a process for preparing the compound according to formula (VIIa) using the diastereomer salts (Va), (Vb), (Vc) and/or (Vd), a process for preparing the compound according to formula (Ia) using the diastereomer salts (Va), (Vb), (Vc) and/or (Vd), the use of the diastereomer salts (Va), (Vb), (Vc) and/or (Vd) for preparing a compound according to formulae (IVa), (VIIa) and/or (Ia); the use of a chiral-substituted tartaric acid ester of the formulae (IIIa) or (IIIb) for preparing the diastereomer salts (Va), (Vb), (Vc) and/or (Vd), and the use of a chiral-substituted tartaric acid ester of the formulae (IIIa) or (IIIb) for preparing a compound of formulae (IVa), (VIIa) and/or (Ia).

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft die Diastereomeren-Salze (Va), (Vb), (Vc) und/oder (Vd), ein Verfahren zur Herstellung der Diastereomeren-Salze (Va), (Vb), (Vc) und/oder (Vd) unter Verwendung eines chiralen substituierten Weinsäureesters der Formel (IIIa) oder (IIIb), ein Verfahren zur Herstellung der Verbindung nach Formel (IVa) unter Verwendung der Diastereomeren-Salze (Va), (Vb), (Vc) und/oder (Vd), ein Verfahren zur Herstellung der Verbindung nach Formel (VIIa) unter Verwendung der Diastereomeren-Salze (Va), (Vb), (Vc) und/oder (Vd), ein Verfahren zur Herstellung der Verbindung nach Formel (Ia) unter Verwendung der Diastereomeren-Salze (Va), (Vb), (Vc) und/oder (Vd), die Verwendung der Diastereomeren-Salze (Va), (Vb), (Vc) und/oder (Vd) zur Herstellung einer der Verbindungen nach Formel (IVa), (VIIa) und/oder (Ia); die Verwendung eines chiralen substituierten Weinsäureesters der Formel (IIIa) oder (IIIb) zur Herstellung der Diastereomeren-Salze (Va), (Vb), (Vc) und/oder (Vd), und die Verwendung eines chiralen substituierten Weinsäureesters der Formel (IIIa) oder (IIIb) zur Herstellung einer der Verbindungen nach Formel (IVa), (VIIa) und/oder (Ia).

WO 2021/074078 A1