

Title (en)

METHODS FOR PREPARING CAPTOPRIL AND ITS ANALOGUES.

Title (de)

VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON CAPTOPRIL UND DESSEN ANALOGEN.

Title (fr)

PROCEDES DE PREPARATION DE CAPTOPRIL ET SES ANALOGUES.

Publication

**EP 0434743 A1 19910703 (EN)**

Application

**EP 89910744 A 19890912**

Priority

US 24420388 A 19880913

Abstract (en)

[origin: WO9002732A1] This invention relates to novel methods for converting a diastereomeric mixture of S-protected derivatives of an orally active inhibitor of an angiotensin-converting enzyme (ACE) and its analogues into its separate optically resolved diastereomeric components. Specifically the invention relates to methods for the preparation of optically purified captopril and its analogs from racemic precursors. This resolution process is achieved through the fractional crystallization of S-protected derivatives of captopril and its precursors, which derivatives are useful for the reason that they are (1) easily prepared from novel precursors, (2) resolvable to their optically purified stereoisomeric species and (3) convertible to non-derivatized stereoisomeric species which correspond to the pharmacologically active inhibitor and its analogues. Novel methods for preparing the derivatives and their precursors are also noted herein. In addition, the novel derivatives and their precursors are also described herein.

Abstract (fr)

Cette invention concerne de nouveaux procédés de conversion d'un mélange diastéréomère de dérivés protégés par S d'un inhibiteur oralement actif d'une enzyme de conversion d'angiotensine (ACE) et ses analogues en ces composants diastéréomères séparés résolus optiquement. Plus particulièrement, l'invention concerne des procédés de préparation de captopril optiquement purifiés et ses analogues à partir de précurseurs racémiques. Ce procédé de résolution est effectué par cristallisation fractionnaire de dérivés protégés par S de captopril et ses précurseurs, lesquels dérivés sont utiles car (1) ils sont facilement préparés à partir de nouveaux précurseurs, (2) ils sont réductibles en leurs espèces stéréoisomères optiquement purifiées et (3) ils sont convertibles en des espèces stéréoisomères non dérivées qui correspondent à l'inhibiteur pharmacologiquement actif et ses analogues. De nouveaux procédés de préparation des dérivés et de leurs précurseurs sont également décrits. De plus, les nouveaux dérivés et leurs précurseurs sont également décrits dans la présente invention.

IPC 1-7

**C07D 205/04; C07D 207/16; C07D 211/34**

IPC 8 full level

**A61K 31/397** (2006.01); **A61K 31/40** (2006.01); **A61K 31/401** (2006.01); **A61P 43/00** (2006.01); **C07D 205/04** (2006.01); **C07D 207/16** (2006.01); **C07D 211/60** (2006.01)

CPC (source: EP)

**A61P 43/00** (2017.12); **C07D 205/04** (2013.01); **C07D 207/16** (2013.01); **C07D 211/60** (2013.01)

Designated contracting state (EPC)

AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)

**WO 9002732 A1 19900322**; AU 4304789 A 19900402; EP 0434743 A1 19910703; EP 0434743 A4 19910925; IL 91581 A0 19900429; IL 91581 A 19930708; JP H04500673 A 19920206

DOCDB simple family (application)

**US 8903960 W 19890912**; AU 4304789 A 19890912; EP 89910744 A 19890912; IL 9158189 A 19890908; JP 51013189 A 19890912