



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:



HR P20161484 T1

HR P20161484 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA  
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

**C07C 227/22** (2006.01)  
**C07C 227/32** (2006.01)      **C07C 229/34** (2006.01)  
**C07C 269/06** (2006.01)      **C07C 271/22** (2006.01)  
**C07D 207/26** (2006.01)      **C07D 207/28** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 16.12.2016.

(21) Broj predmeta: P20161484T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 09.11.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2008000142  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 10.01.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08706986.0  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 10.01.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2008083967  
Datum međunarodne objave: 17.07.2008.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2121578 A2  
Datum objave europske prijave patenta: 25.11.2009.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2121578 B1  
Datum objave europskog patenta: 10.08.2016.

(31) Broj prve prijave: 07100451

(32) Datum podnošenja prve prijave: 12.01.2007.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

**Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH**  
**David Hook, Dianastrasse 12, 4310 Rheinfelden, CH**  
**Thomas Ruch, Fasanenstrasse 13, 4402 Frenkendorf, CH**  
**Bernhard Riss, Rue du Dr. Mangeney 44, 68330 Huningue, FR**  
**Bernhard Wietfeld, Dichleweg 27, 79588 Efringen-Kirchen, DE**  
**Gottfried Sedelmeier, Erlenweg 11, 79227 Schallstadt, DE**  
**Matthias Napp, Pestalozzistrasse 57, 79540 Lörrach, DE**  
**Markus Bänziger, Dahlienstrasse 27, 4416 Bubendorf, CH**  
**Steven Hawker, 24 Melbourne Road, Royston, Herfordshire, GB**  
**Lech Ciszewski, 7 Hamilton Road, Apt. 2, Morristown, NJ 07960, US**  
**Liladhar Murlidhar Waykole, 11 Putters Road, Succasunna, NJ 07876, US**  
**CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

(74) Zastupnik:

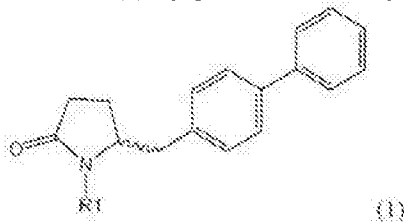
(54) Naziv izuma:

**POSTUPAK ZA PROIZVODNJU 5-BIFENIL-4-AMINO-2-METIL-PENTANSKE KISELINE**

HR P20161484 T1

## PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Spoj, **naznačen time**, da ima sljedeću formulu (1), njegov tautomer, ili njegova sol:

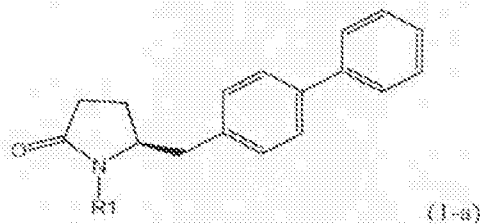


u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil-C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine sljedeći: C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;

10 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil; suksinidimil-skupina; i SiR'R''R''', gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili aromatski sustav prstena koji

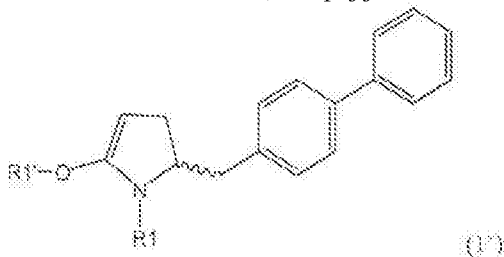
15 ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S(=O)<sub>2</sub>-.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, da ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (1-a):



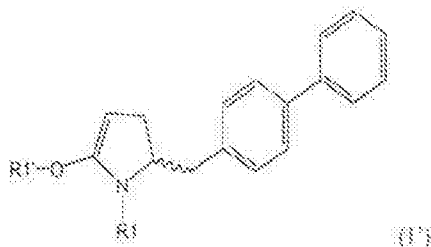
u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina kako je definirana u zahtjevu 1.

- 20 3. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2, **naznačen time**, da ima R1 je vodik.
4. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2, **naznačen time**, da R1 je dušikova zaštitna skupina odabrana od sljedećih: pivaloil, pirolidinilmetil, t-butoksikarbonil, benzil, trietilsilil, acetil, benziloksikarbonil (Cbz) i trimetilsiletoksimetil (SEM).
5. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 4, **naznačen time**, da spoj je enol-tautomer prema sljedećoj formuli (1')



25 u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina kako je definirana u zahtjevu 1 i R1' je vodik.

6. Spoj, **naznačen time**, da ima sljedeću formulu (1<sup>1</sup>), ili njegova sol:

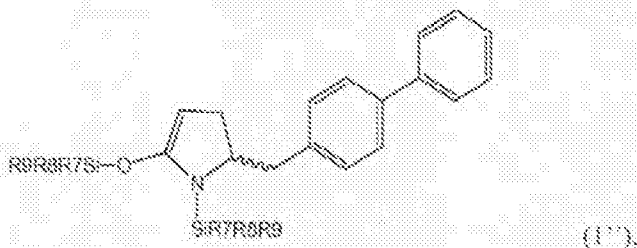


u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil-C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine sljedeći: C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;

30 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil;

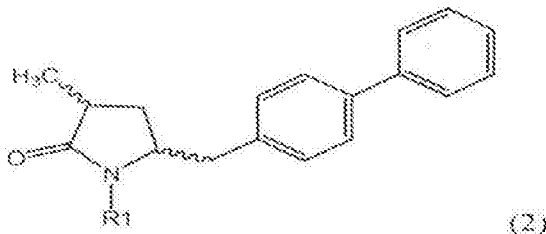
C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil; suksinidimil-skupina; i SiR'R'R", gdje su R, R' i R" međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S(=O)<sub>2</sub>, a R1' je vodikova ili kisikova zaštitna skupina formule SiR7R8R9, gdje su R7, R8 i R9 međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil ili C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril.

7. Spoj prema zahtjevu 6, **naznačen time, da** ima strukturu prikazanu u sljedećoj formuli (1'')

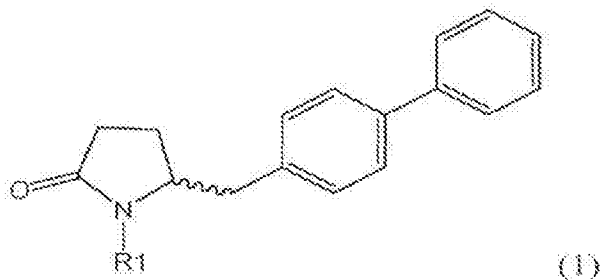


u kojoj su R7, R8 i R9 međusobno neovisno C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, poželjno metil ili etil.

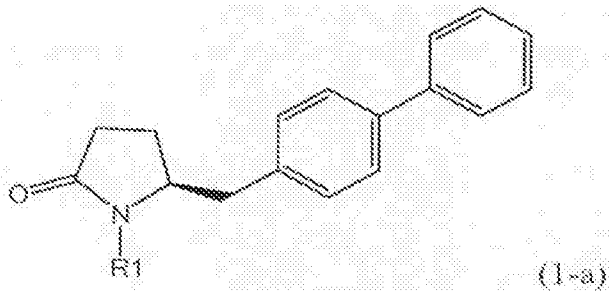
8. Postupak za proizvodnju spoja prema sljedećoj formuli (2) ili njegove soli.



u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća metilaciju spoja prema sljedećoj formuli (1) ili njegove soli:



u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, poželjno obuhvaća metilaciju spoja prema sljedećoj formuli (1-a), ili njegove soli:

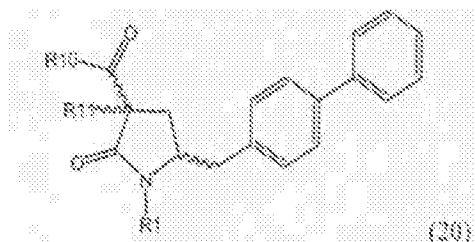


u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

9. Postupak prema zahtjevu 8, **naznačen time, da** obuhvaća obradu spoja formule (1) ili njegove soli, s lužinom i metilacijskim reagensom, poželjno obuhvaća obradu spoja formule (1-a) ili njegove soli.

10. Postupak prema zahtjevu 8, **naznačen time, da** obuhvaća sljedeće:

a) obrada spoja formule (1) ili njegove soli, prvo s lužinom i zatim sa spojem formule YCO<sub>2</sub>R, pri čemu Y je halogen ili -OR' i gdje su R i R' neovisno odabrani od alkila, arila i arilalkila, kako bi se dobio spoj sljedeće formule (20) ili njegova sol:



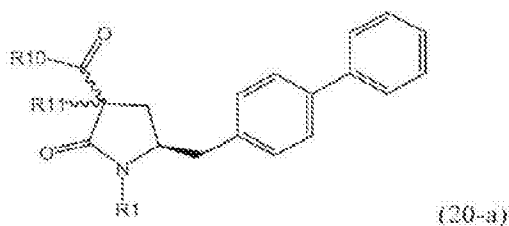
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, R11 je vodik i R10 je OR, dok R je alkil, aril ili arilalkil;

b) reakcija dobivenog spoja formule (20) s lužinom i metilacijskim reagensom, kako bi se dobio spoj formule (20) ili njegova sol, pri čemu R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, R11 je metil i R10 je OR, dok R je alkil, aril ili arilalkil:

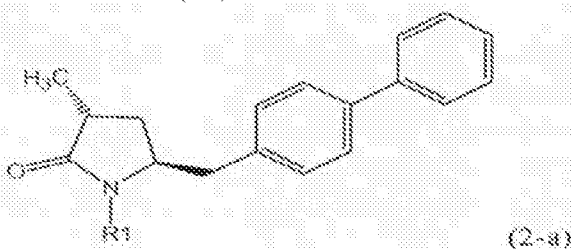
c) po izboru, obrada spoja formule (20) gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, R11 je metil i R10 je OR, dok R je alkil, aril ili arilalkil, sa saponifikacijskim reagensom, kako bi se dobio spoj formule (20) ili njegova sol, gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, R11 je metil i R10 je OH;

d) obrada spoja dobivenog u koraku (b) ili (c) pod dekarboksilacijskim uvjetima za dobivanje spoja formule (2).

11. Postupak prema zahtjevu 10, **naznačen time**, daje konfiguracija spoja formule (20) u skladu sa sljedećom formulom (20-a):

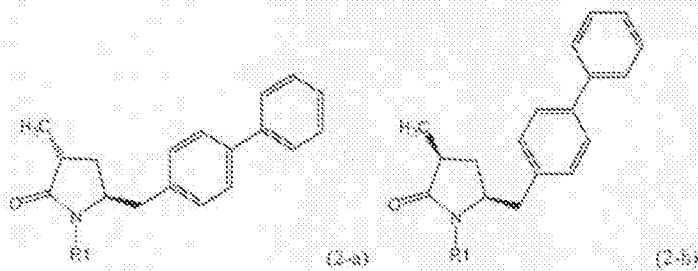


12. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 8 do 10, **naznačen time**, da se proizvodi spoj ili njegova sol, koji/koja ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (2-a):



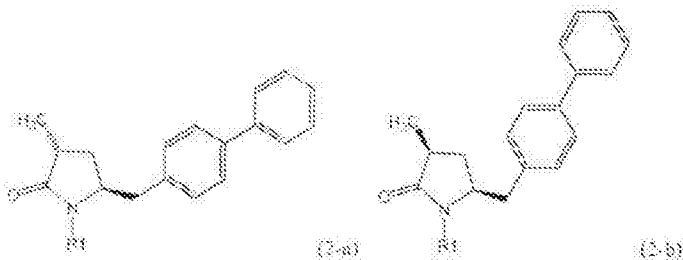
u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

13. Postupak prema zahtjevu 8, **naznačen time**, da se kao početni materijal upotrebljava spoj u skladu s formulom (1-a) ili njegova sol, i proizvodi se spoj u skladu sa formulom (2-a) ili njegova sol, u dijastereomernom omjeru sljedećih dijastereomera (2-a) prema (2-b):



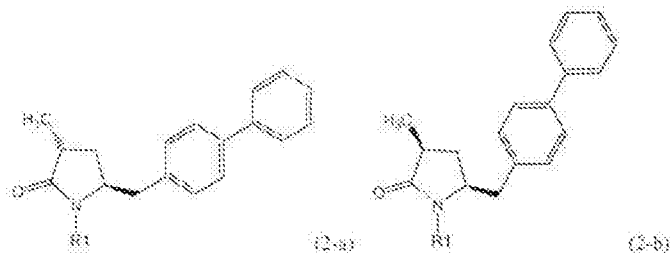
kao većem od 60 : 40, poželjno većem od 70 : 30.

14. Postupak prema zahtjevu 9, **naznačen time**, da spoj prema formuli (1) ili njegova sol, ima konfiguraciju u skladu s formulom (1-a) i pri čemu se proizvodi spoj prema formuli (2), u omjeru sljedećih dijastereomera (2-a) prema (2-b):



od najmanje 80 : 20, poželjno najmanje 91:9.

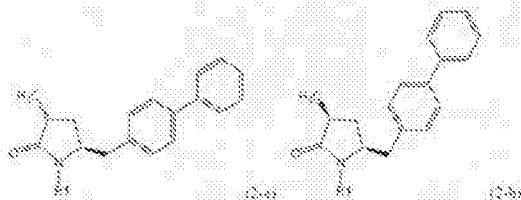
15. Postupak prema zahtjevu 10 ili 11, **naznačen time, da** spoj prema formuli (1) ili njegova sol, ima konfiguraciju u skladu s formulom (1-a) i pri čemu se proizvodi spoj prema formuli (2) u omjeru sljedećih diastereomera (2-a) prema (2-b):



5

od najmanje 55 : 45.

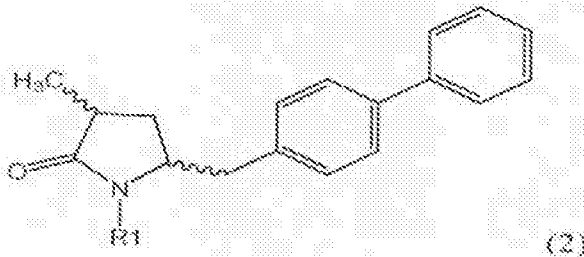
16. Postupak prema zahtjevu 10 ili 11, **naznačen time, da** spoj prema formuli (1) ili njegova sol, ima konfiguraciju u skladu s formulom (1-a) i pri čemu se proizvodi spoj prema formuli (2) u omjeru sljedećih diastereomera (2-a) prema (2-b):



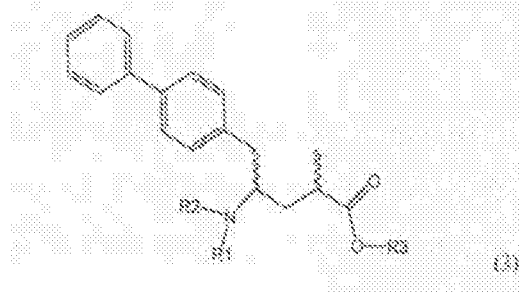
10

od najmanje 29 : 79.

17. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 8 do 16, **naznačen time, da** dobiveni spoj sljedeće formule (2) ili njegova sol:



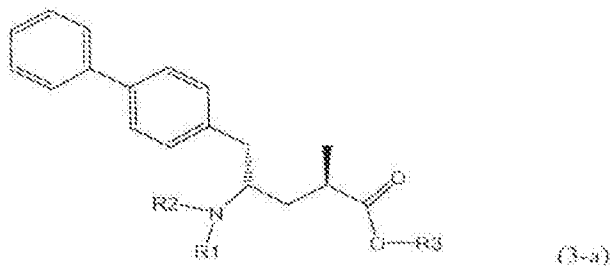
reagira sa sredstvom za otvaranje prstena, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (3) ili njegova sol:



15

pri čemu su R1 i R2 u gornjim formulama, međusobno neovisno vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R3 je vodik ili alkil.

18. Postupak prema zahtjevu 17, **naznačen time, da** se dobiva spoj koji ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (3-a) ili njegova sol:

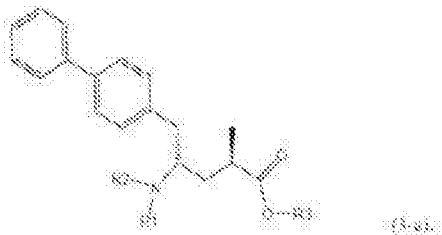


20

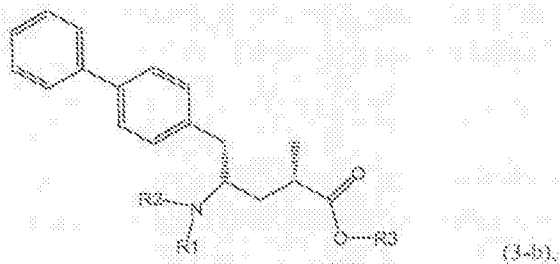
u kojoj su R1 i R2 međusobno neovisno vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R3 je vodik ili alkil.

19. Postupak prema zahtjevu 17 ili 18, **naznačen time, da** su R1 i R2 vodik i R3 je etil-skupina.

20. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 17 do 19, **naznačen time, da** se proizvodi spoj prema formuli (3) u omjeru sljedećih diastereomera (3-a) prema (3-b):

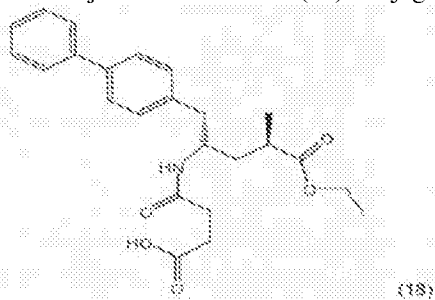


5



od najmanje 60 : 40, poželjno najmanje 70 : 30, još poželjnije najmanje 80 : 20, još bolje od najmanje 90 : 10, te najbolje od najmanje 99 : 1.

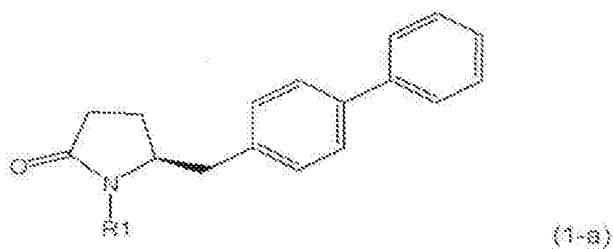
21. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (18) ili njegove soli:



10

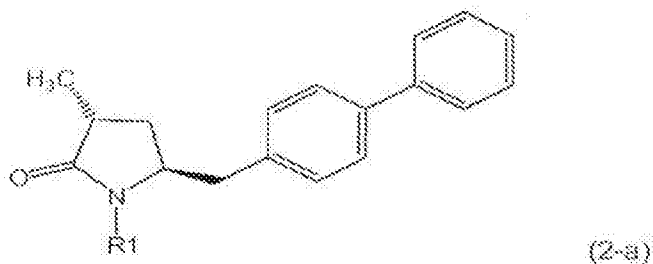
**naznačen time, da** obuhvaća sljedeće korake:

a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (1-a) ili njegove soli:

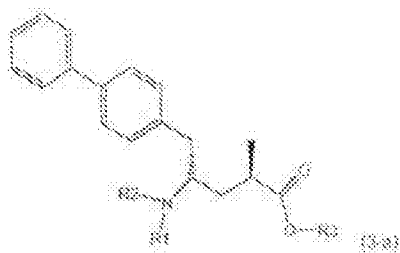


b) metilacija spoja prema formuli (1-a) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (2-a) ili njegova sol:

15

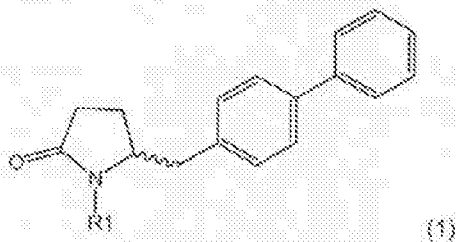


c) reakcija spoja prema formuli (2-a) ili njegove soli, sa sredstvom za otvaranje prstena, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (3-a) ili njegova sol:



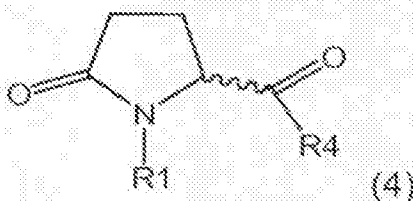
d) reakcija spoja prema formuli (3-a) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (18) ili njegova sol; pri čemu su R1 i R2 u gornjim formulama, međusobno neovisno vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R3 je vodik ili alkil.

5 22. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:



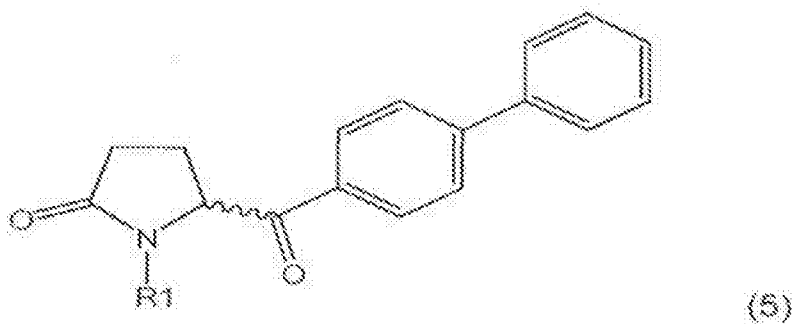
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća sljedeće korake:

a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (4) ili njegove soli:



10 gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R4 je CO-aktivacijska skupina;

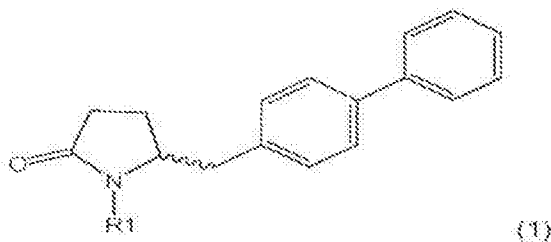
b) reakcija spoja prema formuli (4) ili njegove soli, s bifenilnim spojem, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (5) ili njegova sol:



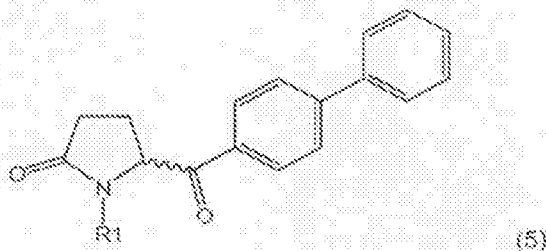
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina; i

15 c) redukcija spoja prema formuli (5) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol.

23. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:

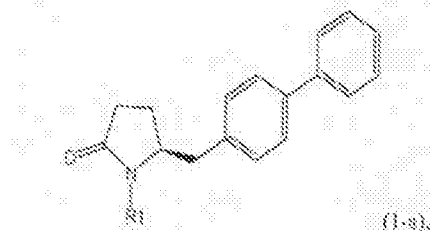
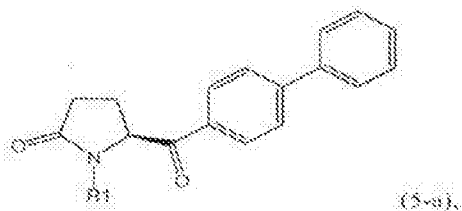
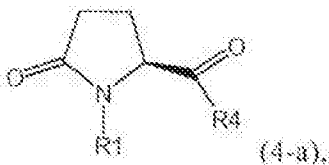


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća redukciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (5) ili njegove soli:



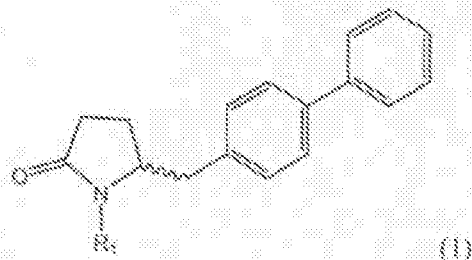
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, kako bi se dobio spoj formule (1) ili njegova sol.

24. Postupak prema zahtjevu 23, **naznačen time, da** redukcija obuhvaća obradu s vodikom i katalizatorom.
25. Postupak prema zahtjevu 24, **naznačen time, da** katalizator je Pd/C.
- 5 26. Postupak prema zahtjevu 25, **naznačen time, da** katalizator Pd/C je odabran iz skupine koju čine: 10% Pd/C tipa K-0218, 10% tipa PD CP 4505 D/R, 5% Pd/C tipa 39, 10% Pd/C tipa 39, 10% Pd/C tipa 39 (7200), 20% Pd/C tipa 91, 10% Pd/C tipa 338, 10% Pd/C tipa 394, 10% Pd/C tipa 394 (6065), 10% Pd/C tipa 394 (6249), 10% Pd/C tipa 395, 10% Pd/C tipa 395 (6002), 10% Pd/C tipa mod (72595), 15% Pd/C tipa A101023 i 15% Pd/C tipa A502085.
27. Postupak prema zahtjevu 22, **naznačen time, da** CO-aktivacijska skupina je odabrana iz skupine koju čine: dimetilamino, morfolinil, imidazolil, metilmektoksiamino, -O-metil, -O-etil, klor, brom, pivaloil i acetil.
- 10 28. Postupak prema zahtjevu 27, **naznačen time, da** R4 u formuli (4) je morfolinil i bifenilni spoj koji se koristi u koraku b) je bifenilmagnezij-halid.
29. Postupak prema zahtjevu 27, **naznačen time, da** R4 u formuli (4) je klorid i bifenilni spoj koji se koristi u koraku b) je bifenil.
- 15 30. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 22 do 29, **naznačen time, da** je konfiguracija spojeva s formulama (4), (5) i (1) ili njihovih soli, u skladu sa sljedećim formulama (4-a), (5-a) i (1-a):



gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R4 je CO-aktivacijska skupina.

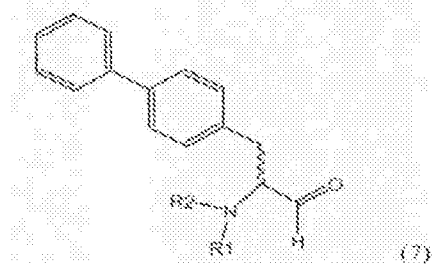
- 20 31. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:



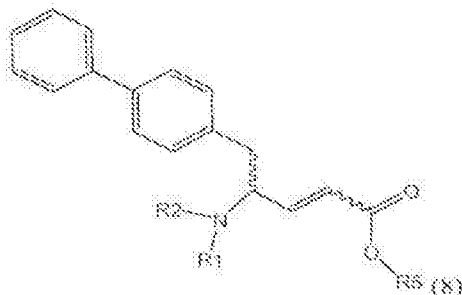
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća sljedeće korake:

- a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (7) ili njegove soli:



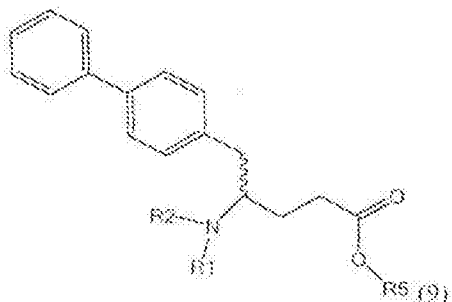


gdje su R1 i R2 međusobno neovisno vodikova ili dušikova zaštitna skupina,  
 b) reakcija spoja prema formuli (7) ili njegove soli, u Wittigovoj reakciji, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (8) ili njegova sol:



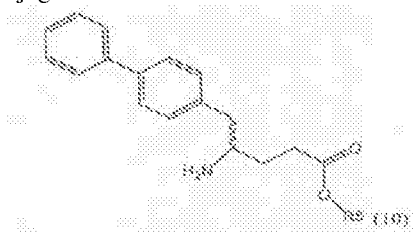
5

gdje su R1 i R2 međusobno neovisno vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R5 je vodik ili alkil,  
 c) redukcija spoja prema formuli (8) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (9) ili njegova sol:



10

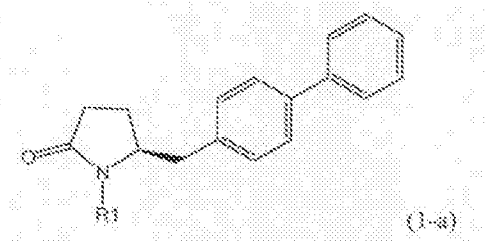
gdje su R1 i R2 međusobno neovisno vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R5 je vodik ili alkil,  
 d) po izboru, odstranjivanje dušikovih zaštitnih skupina, čime se dobiva spoj u skladu sa sljedećom formulom (10) ili njegova sol:

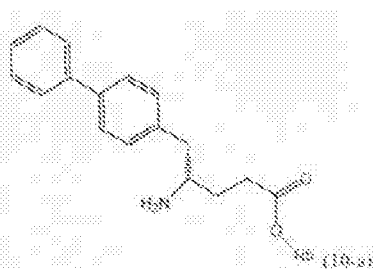
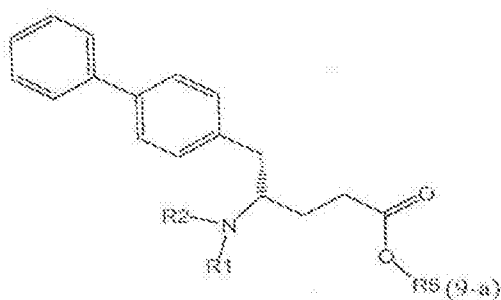
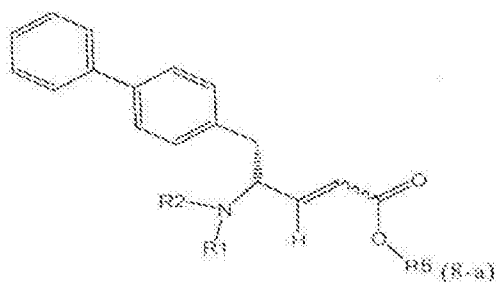
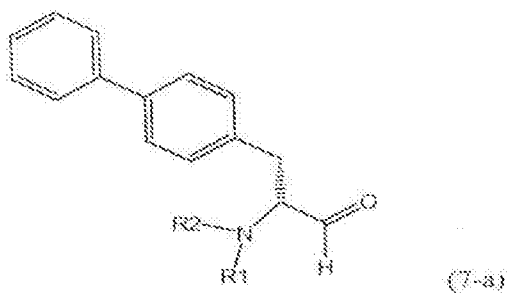


15

gdje R5 je vodik ili alkil, i  
 e) reakcija spoja prema formuli (10) ili njegove soli, pri čemu R5 je vodik ili alkil, pod uvjetima zatvaranja prstena, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol.

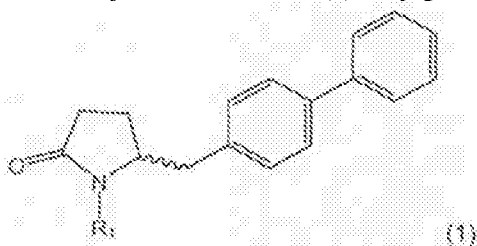
32. Postupak prema zahtjevu 31, **naznačen time**, daje konfiguracija spojeva ili njihovih soli, u skladu sa sljedećim formulama (1-a) i od (7-a) do (10-a):



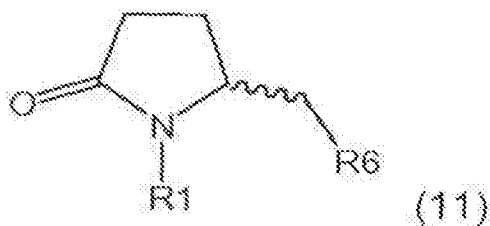


gdje su R1 i R2 u gornjim formulama, međusobno neovisno vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R5 je vodik ili alkil.

- 5 33. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:



gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća reakciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (11) ili njegove soli:



gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R6 je izlazna skupina, s aktiviranim bifenilnim spojem.

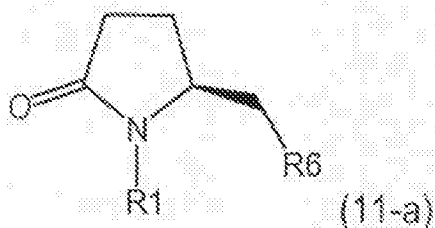
34. Postupak prema zahtjevu 33, **naznačen time, da** aktivirani bifenilni spoj je bifenilmagnezij-halid.

35. Postupak prema zahtjevu 33 ili 34, **naznačen time, da** se reakcija spoja formule (11) s aktiviranim bifenilnim spojem, izvodi pod reakcijskim uvjetima Fe-kataliziranog ili Mn-kataliziranog križnog spajanja.

36. Postupak prema zahtjevu 35, **naznačen time, da** se reakcija spoja formule (11) s aktiviranim bifenilnim spojem, izvodi uz pomoć uporabe FeCl<sub>3</sub>, Fe(acac)<sub>3</sub> ili MnCl<sub>2</sub>

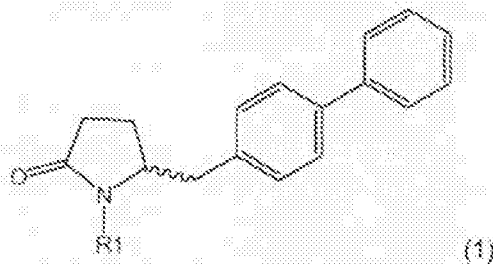
37. Postupak prema zahtjevu 33 ili 34, **naznačen time, da** se reakcija spoja formule (11) s aktiviranim bifenilnim spojem, izvodi u prisutnosti metalne soli kao aditiva.

38. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 33 do 37, **naznačen time, da** se upotrebljava spoj formule (11) ili njegova sol, koji ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (11-a):



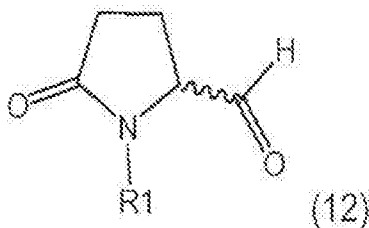
pri čemu R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R6 je izlazna skupina.

39. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:



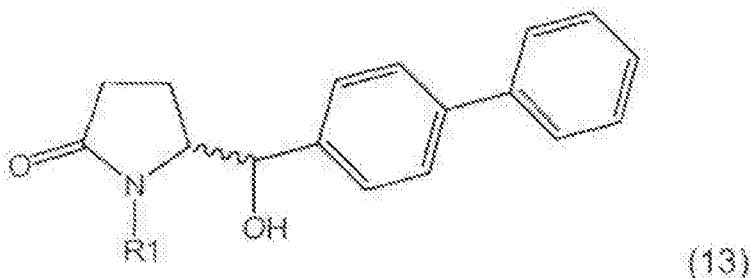
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća sljedeće korake:

a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (12) ili njegove soli:



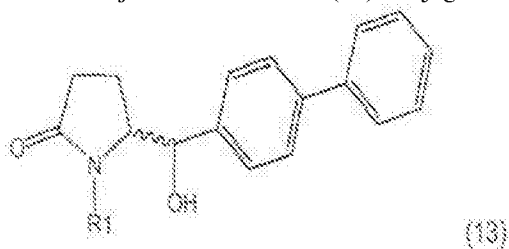
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina,

b) reakcija spoja prema formuli (12) ili njegove soli, s aktiviranim (naime metaliranim) bifenilnim spojem, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (13) ili njegova sol:



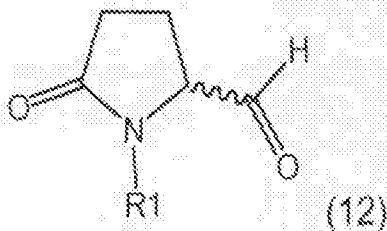
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, i

c) redukcija spoja prema formuli (13) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol.  
40. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (13) ili njegove soli:



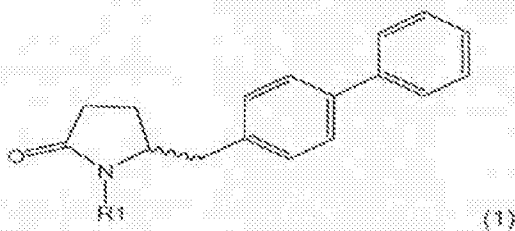
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina,

5 **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća reakciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (12) ili njegove soli:

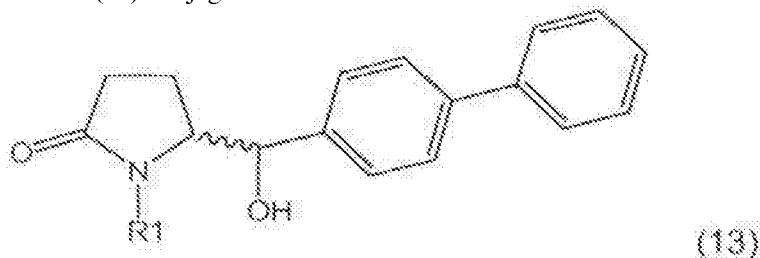


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina s aktiviranim bifenilnim spojem, kako bi se dobio spoj formule (13).

41. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:

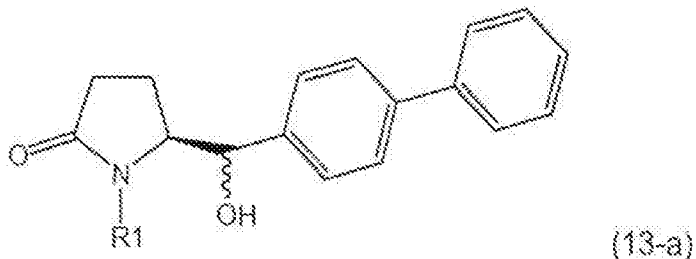
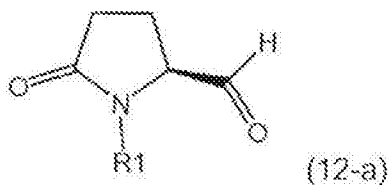


10 gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačena time, da** navedeni postupak obuhvaća redukciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (13) ili njegove soli:



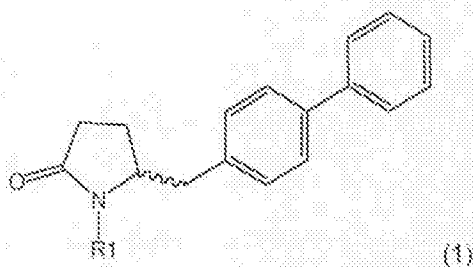
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol.

15 42. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 39 do 41, **naznačen time, da** spojevi s formulama (12) i (13) ili njihove soli, imaju konfiguraciju u skladu sa sljedećim formulama (12-a) i (13-a):



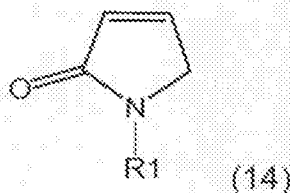
pri čemu u gornjim formulama R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

43. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:

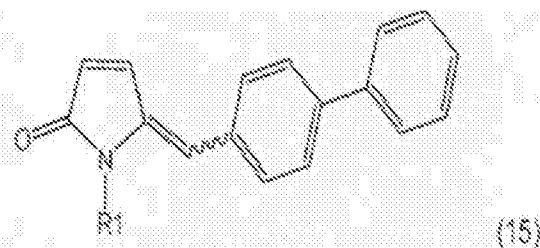


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća sljedeće korake:

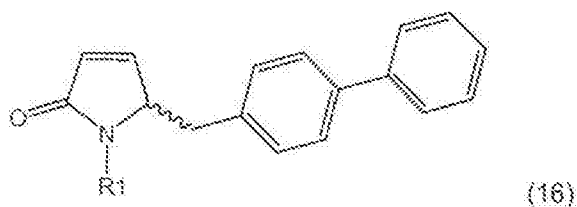
a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (14) ili njegove soli:



b) reakcija spoja prema formuli (14) ili njegove soli, s 4-formil-bifenilom, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (15) ili njegova sol:



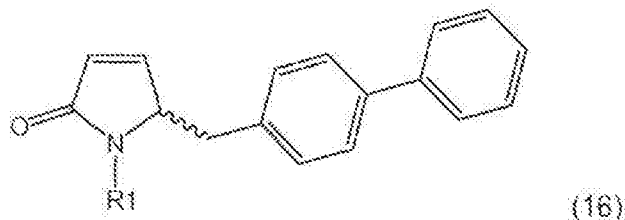
c) hidrogenizacija spoja formule (15) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (16) ili njegova sol:



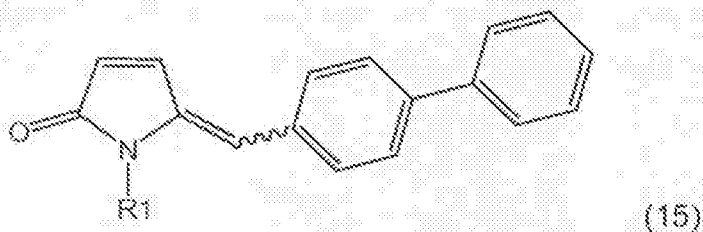
i

d) redukcija spoja prema formuli (16) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol; pri čemu u formulama od (14) do (16), R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

44. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (16) ili njegove soli:

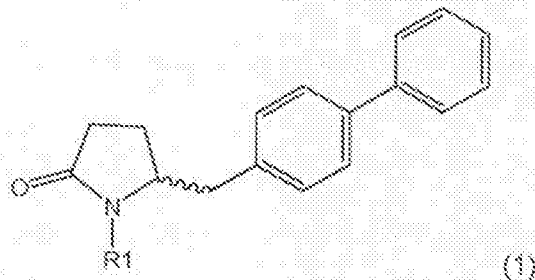


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća hidrogenizaciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (15) ili njegove soli:

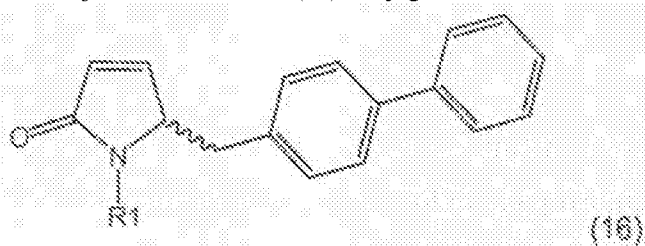


pri čemu R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (16).

45. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:

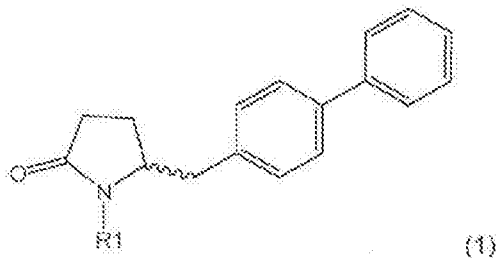


5 gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća redukciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (16) ili njegove soli:

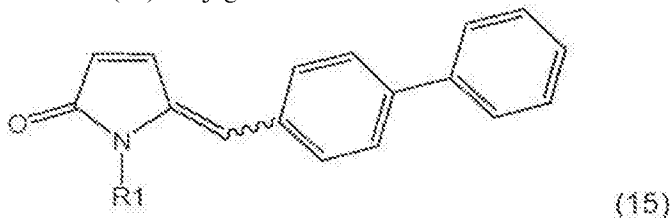


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol.

46. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:

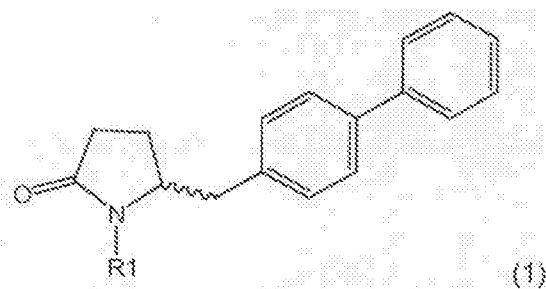


10 gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća hidrogenizaciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (15) ili njegove soli:

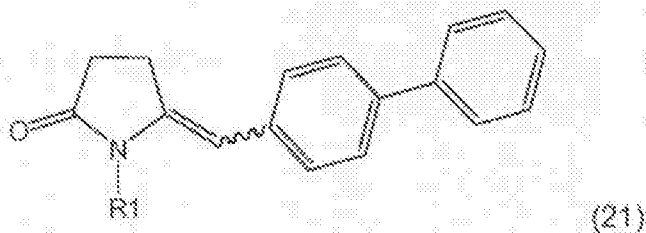


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol.

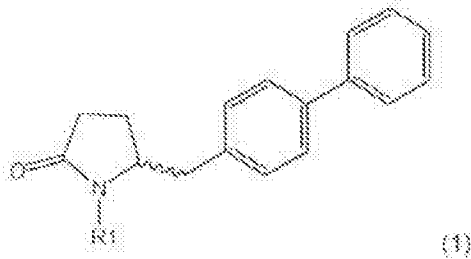
15 47. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:



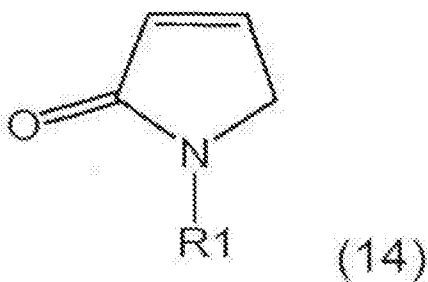
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća hidrogenizaciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (21) ili njegove soli:



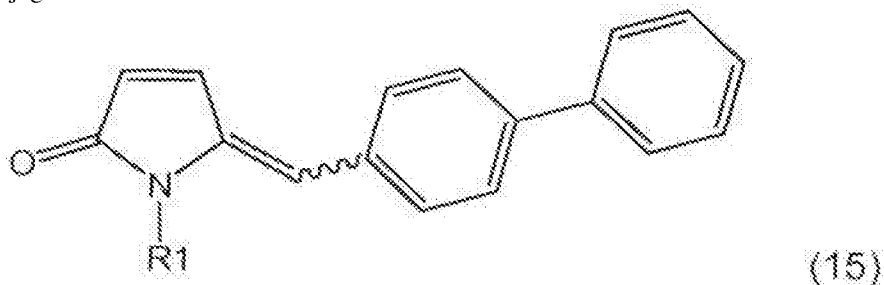
- 5      gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol.  
48. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) **ili** njegove soli:



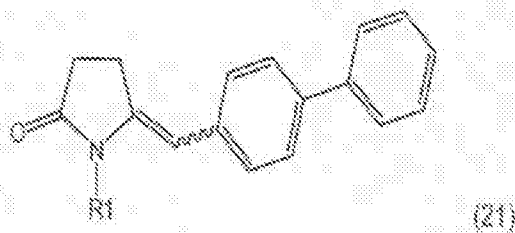
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća sljedeće korake:  
a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (14) ili njegove soli:



- 10      b) reakcija spoja prema formuli (14) ili njegove soli, s 4-formil-bifenilom, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (15) ili njegova sol:



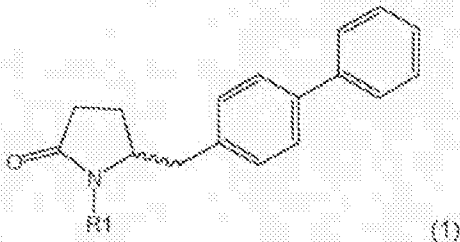
- 15      c) redukcija spoja formule (15) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (21) ili njegova sol:



i

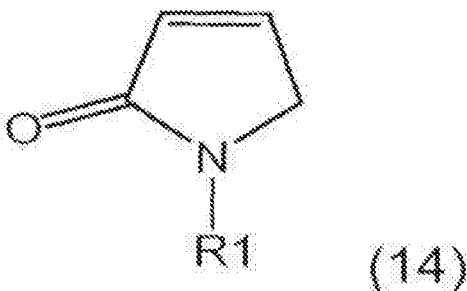
d) hidrogenizacija spoja prema formuli (21) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol, pri čemu u formulama (14), (15) i (21), R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

5 49. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:

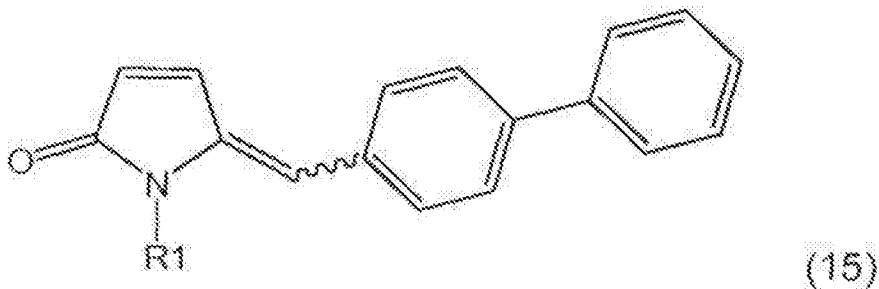


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća sljedeće korake:

a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (14) ili njegove soli:



10 b) reakcija spoja prema formuli (14) ili njegove soli, s 4-formil-bifenilom, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (15) ili njegova sol:

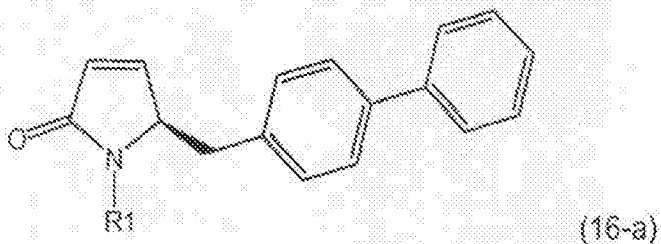
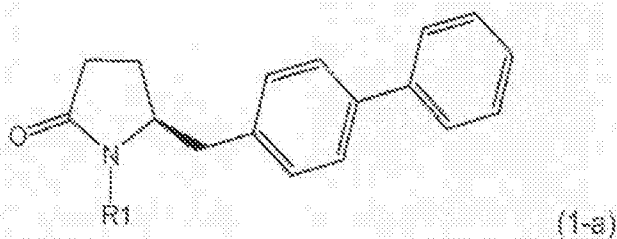


c) hidrogenizacija spoja formule (15) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol; pri čemu u formulama (14) i (15), R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

15 50. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 43, 44, 46, 47 i 48, **naznačen time, da** se hidrogenizacija izvodi pod reakcijskim uvjetima enantioselektivne hidrogenizacije.

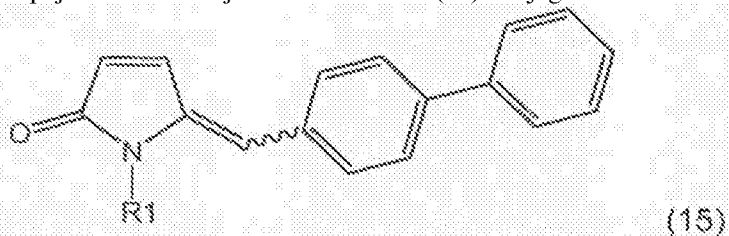
51. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 43 do 50, **naznačen time, da** spojevi s formulama (1) i (16) ili njihove soli, imaju konfiguraciju u skladu sa sljedećim formulama (1-a) i (16-a):



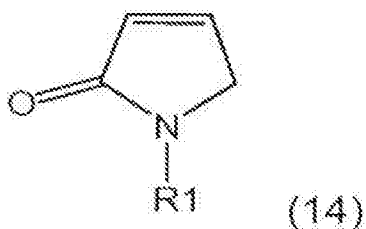


pri čemu u gornjim formulama, R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

52. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (15) ili njegove soli:

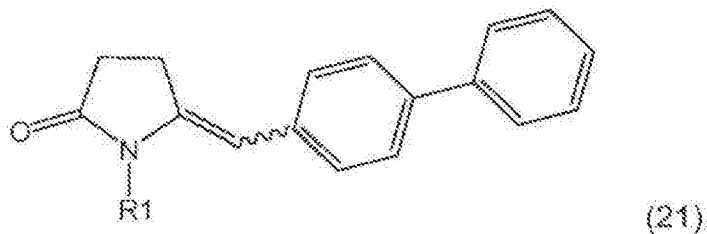


5 gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća reakciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (14) ili njegove soli:

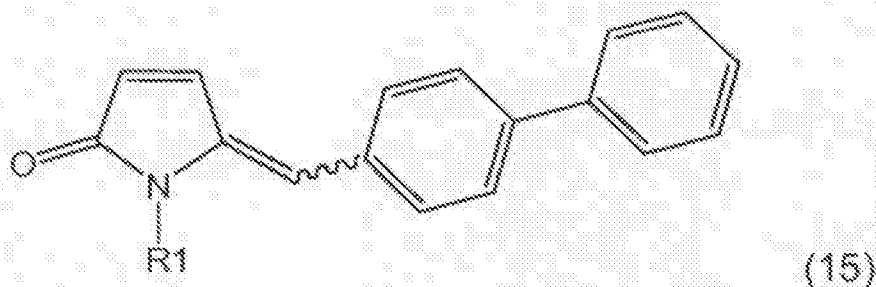


s 4-formil-bifenilom, kako bi se dobio spoj formule (15).

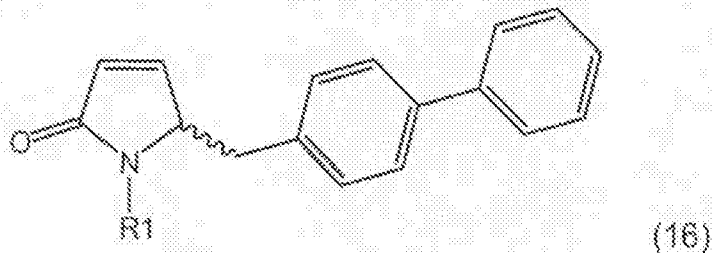
53. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (21) ili njegove soli:



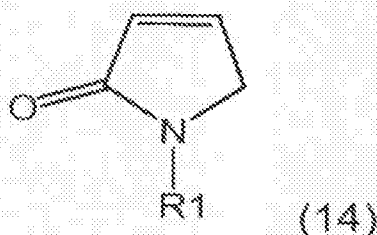
10 gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća redukciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (15) ili njegove soli:



gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, kako bi se dobio spoj formule (21).  
54. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (16) ili njegove soli:

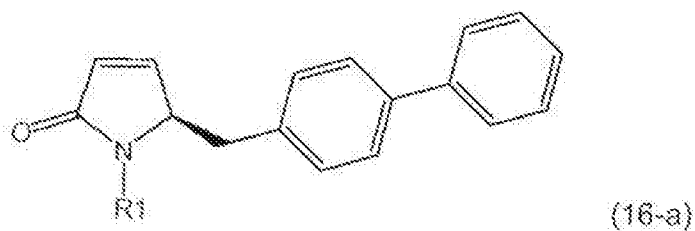


5 gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća reakciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (14) ili njegove soli:



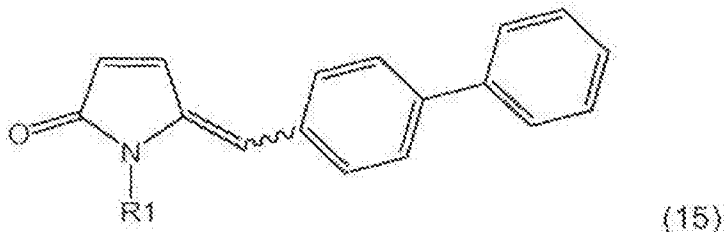
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, sa spojem 4-metil-bifenil formule 4-bifenil-CH<sub>2</sub>-X, gdje X je izlazna skupina, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (16) ili njegova sol, u prisutnosti lužine, poželjno u prisutnosti lužine i kiralne faze prijelaznog katalizatora.

10 55. Postupak prema zahtjevu 54, **naznačen time, da** je konfiguracija spoja formule (16) ili njegove soli, u skladu sa sljedećom formulom (16-a):

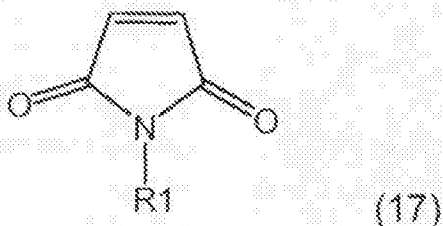


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

15 56. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (15) ili njegove soli:

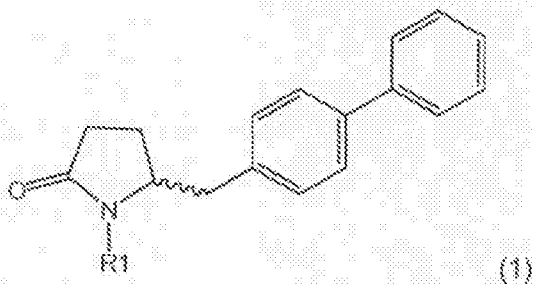


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** obuhvaća reakciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (17) ili njegove soli:



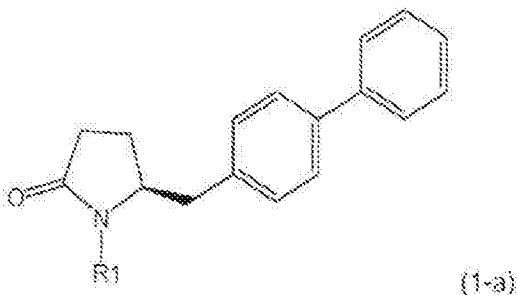
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, s organometalnim reagensom izvedenim iz 4-metil-bifenila, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (15) ili njegova sol.

57. Uporaba spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:



gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačena time, da** služi kao intermedijer ili početni materijal u sintezi N-(3-karboksil-1-oksopropil)-(4S)-(p-fenilfenilmetil)-4-amino-(2R)-metil-butanska kiselina-etilester predlijeka kao NEP-inhibitora, ili njegove soli.

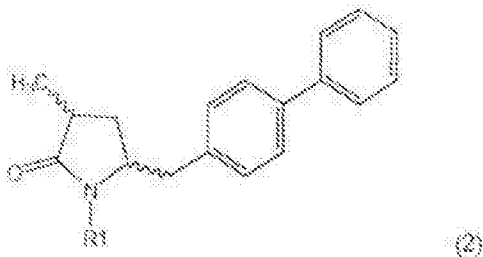
58. Uporaba prema zahtjevu 57, **naznačena time, da** spoj ili njegova sol ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (1-a):



gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

59. Uporaba prema zahtjevu 58, **naznačena time, da** se sinteza provodi u skladu s postupkom opisanom u zahtjevu 21.

60. Spoj ili njegova sol, **naznačen/a time, da** je u skladu sa sljedećom formulom (2):



u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine sljedeći:

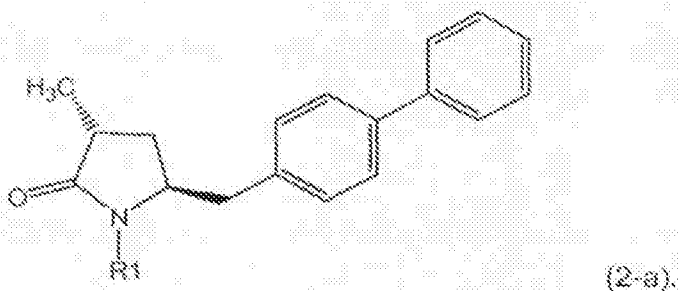
C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;

C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil;

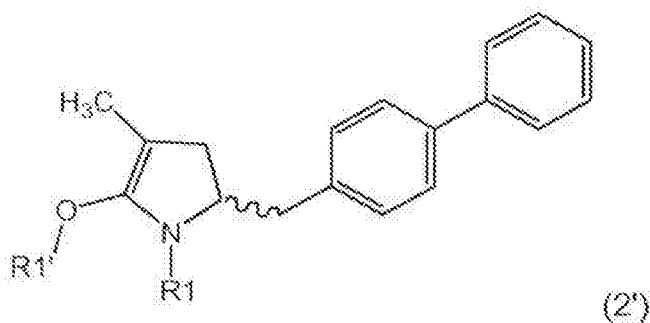
C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil;

sukcinidimil-skupina; i SiR'R''R''', gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S(=O)<sub>2</sub>, koji poželjno ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (2-a):



61. Spoj prema zahtjevu 60, **naznačen time, da** u formuli (2-a), R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana od pivaloila i t-butiloksikarbonila (BOC).

62. Spoj ili njegova sol, **naznačen/a time, da** je u skladu sa sljedećom formulom (2'):



5

u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili trisupstituirana s

tri-C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine sljedeći:

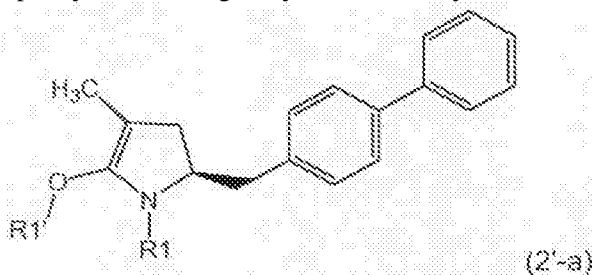
10

C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;

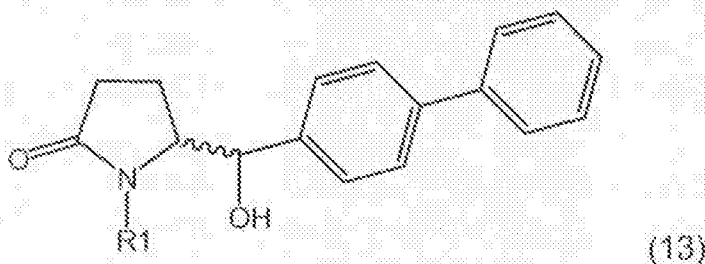
C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil; sukcinidimil-skupina; i SiR'R''R''', gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranim od dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S(=O)<sub>2</sub>, i

15

R1' je vodikova ili kisikova zaštitna skupina formule SiR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, pri čemu su R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> i R<sup>9</sup> međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil ili C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril, koji poželjno ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (2'-a):



63. Spoj ili njegova sol, **naznačen/a time, da** je u skladu sa sljedećom formulom (13):

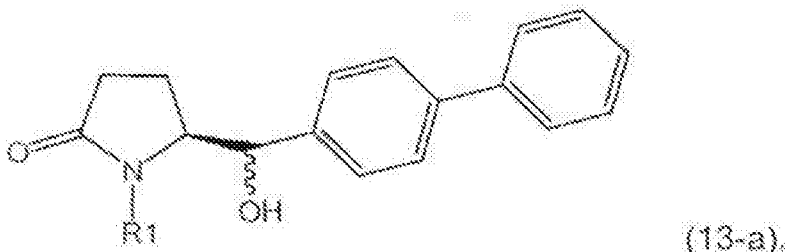


20

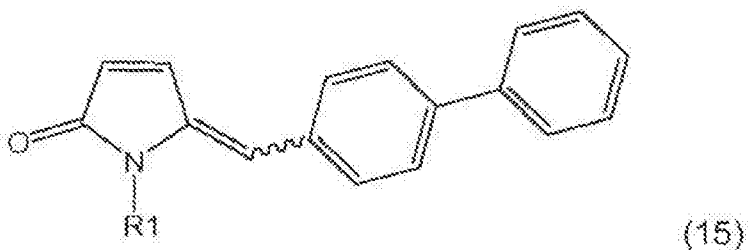
u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine sljedeći:

C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;  
 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil;  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil;

5 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil;  
 sukcinidimil-skupina; i SiR'R''R''', gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil-  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili  
 aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od  
 dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S(=O)<sub>2</sub>, koji poželjno ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (13-a):



10 64. Spoj ili njegova sol, **naznačen/a time**, da je u skladu sa sljedećom formulom (15):

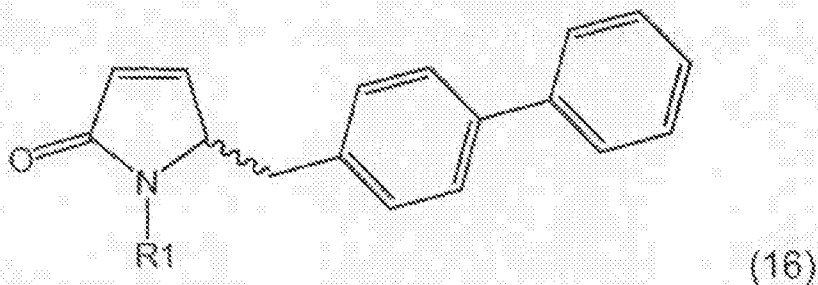


u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili  
 trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten  
 ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine  
 15 sljedeći:

C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;  
 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil;  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil;  
 C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil;

20 sukcinidimil-skupina; i SiR'R''R''', gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil-  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili  
 aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od  
 dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S(=O)<sub>2</sub>.

65. Spoj ili njegova sol, **naznačen/a time**, da je u skladu sa sljedećom formulom (16):

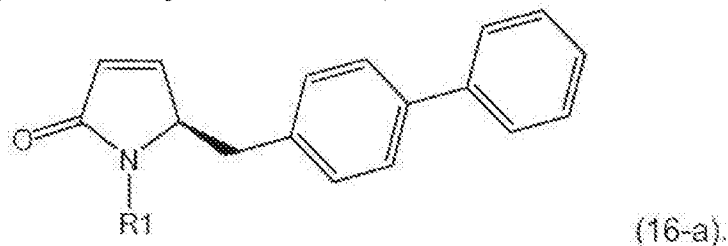


25 u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili  
 trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten  
 ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine  
 sljedeći:

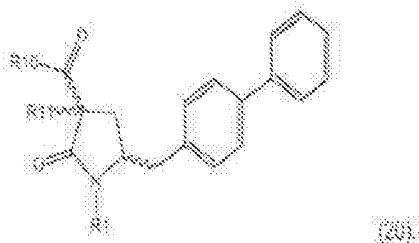
30 C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;

C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
 alkoksi karbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil; sukcinidimil-skupina; i SiR'R''R''',  
 gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je

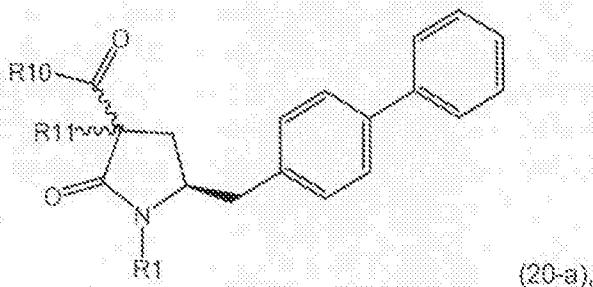
monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S(=O)<sub>2</sub>, koji poželjno ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (16-a):



5 66. Spoj ili njegova sol, **naznačen/a time**, da je u skladu sa sljedećom formulom (20):



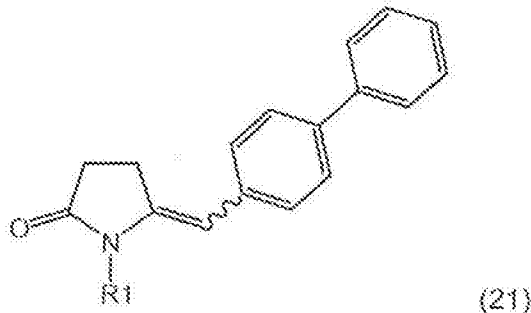
koji poželjno ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (20-a):



pri čemu u gornjoj formuli, R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine sljedeći: C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;

C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil; suksinidimil-skupina; i SiR'R''R''', gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S(=O)<sub>2</sub>, R10 je skupina -OR gdje R je C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil i R11 je vodik ili metil.

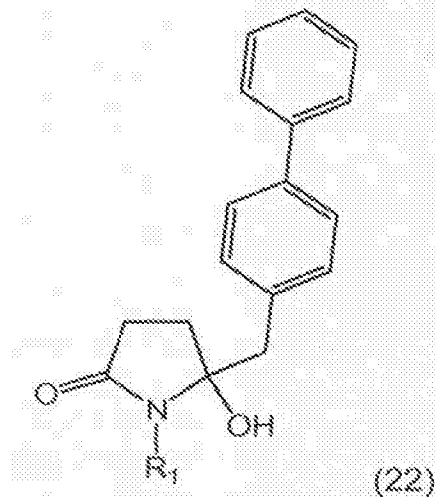
20 67. Spoj ili njegova sol, **naznačen/a time**, da je u skladu sa sljedećom formulom (21):



u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine sljedeći: C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;

C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi karbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil; sukcinidimil-skupina; i SiR'R''R''', gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S-(=O)<sub>2</sub>.

68. Spoj ili njegova sol, **naznačen/a time**, da je u skladu sa sljedećom formulom (22):



u kojoj R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina odabrana iz skupine koju čine: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil, koja je mono- ili di- ili trisupstituirana s tri- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkilsilil- C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilom, ili heterocikličkom skupinom, dok je arilni prsten ili heterociklička skupina nesupstituiran/a ili supstituiran/a s jednim, dva ili tri ostatka odabrana iz skupine koju čine sljedeći:

C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-valkil, hidroksil, C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkanoil-oksi, halogen, nitro, cijano, i CF<sub>3</sub>;

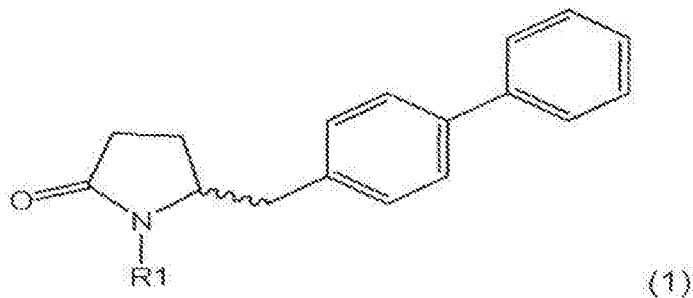
C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkoksikarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkeniloksikarbonil;

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkilkarbonil; C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-arilkarbonil; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil;

C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-aril- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksikarbonil; alil; cinamil; sulfonil; sulfenil;

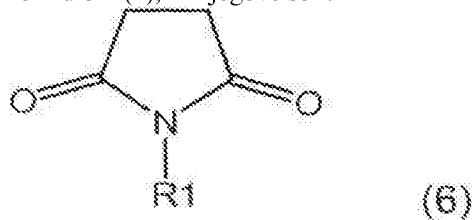
sukcinidimil-skupina; i SiR'R''R''', gdje su R', R'' i R''' međusobno neovisno C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-alkil, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-aril ili fenil- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkil; pri čemu navedeni heterociklil je monociklički ili policiklički, nezasićeni, djelomično zasićeni, zasićeni ili aromatski sustav prstena koji ima od 5 do 14 atoma prstena i s jednim ili više heteroatoma neovisno odabranima od dušika, kisika, sumpora, S(=O)- ili S-(=O)<sub>2</sub>.

69. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:

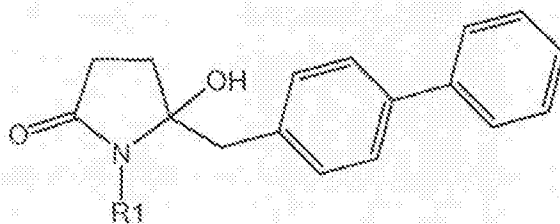


gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time**, da obuhvaća sljedeće korake:

a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (6), ili njegove soli:

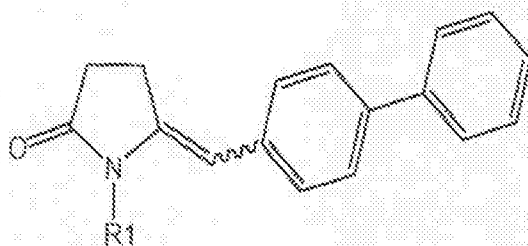


b) reakcija spoja prema formuli (6) ili njegove soli, s organometalnim reagensom izvedenim iz 4-metil-bifenila, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (22) ili njegova sol:



(22)

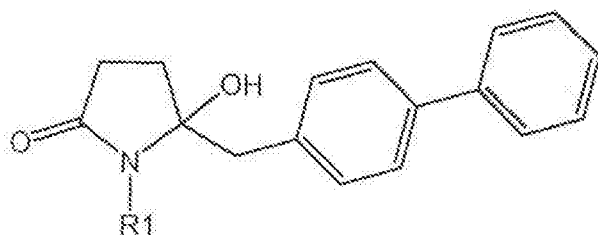
c) dehidracija spoja formule (22) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (21) ili njegova sol:



(21)

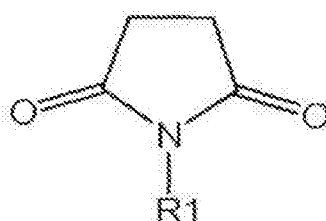
5 d) hidrogenizacija spoja prema formuli (21) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (1) ili njegova sol, pri čemu u formulama (6), (22) i (21), R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

70. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (22) ili njegove soli:



(22)

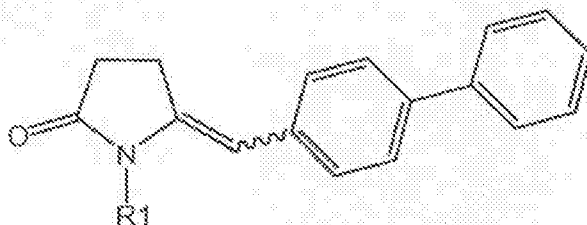
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća reakciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (6) ili njegove soli:



(6)

gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, s organometalnim reagensom izvedenim iz 4-metil-bifenila, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (22) ili njegova sol.

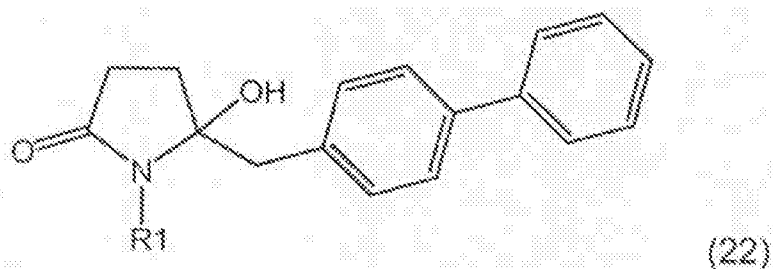
71. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (21) ili njegove soli:



(21)

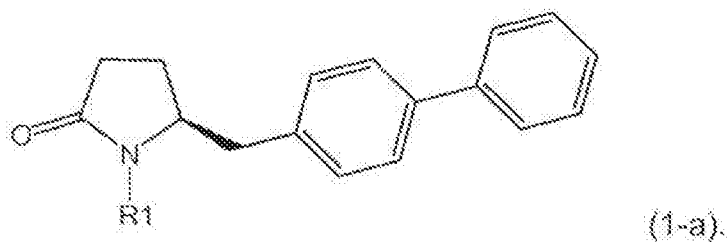
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, **naznačen time, da** navedeni postupak obuhvaća dehidraciju spoja u skladu sa sljedećom formulom (22) ili njegove soli:





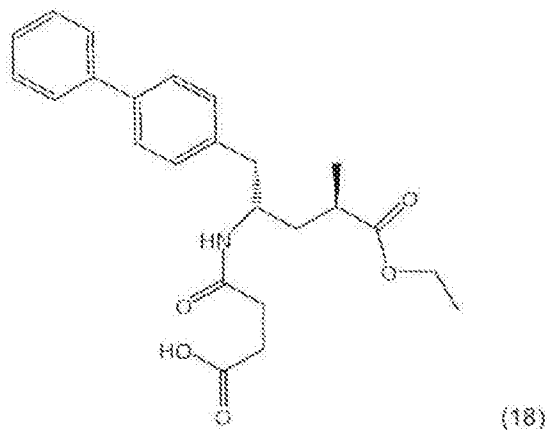
gdje R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (21) ili njegova sol.

72. Postupak prema zahtjevu 69, **naznačen time, da** se hidrogenizacija izvodi pod reakcijskim uvjetima enantioselektivne hidrogenizacije.
- 5 73. Postupak prema zahtjevu 69 ili **72, naznačen time, da** spoj formule (1) ili njegova sol, ima konfiguraciju u skladu sa sljedećom formulom (1-a):



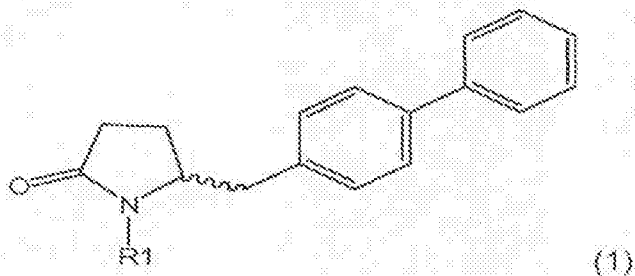
pri čemu u gornjoj formuli, R1 je vodikova ili dušikova zaštitna skupina.

74. Postupak za proizvodnju spoja u skladu sa sljedećom formulom (18) ili njegove soli:

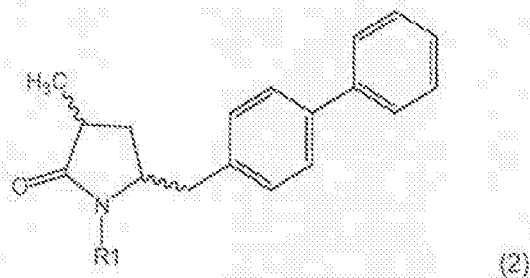


- 10 **naznačen time, da** obuhvaća sljedeće korake:

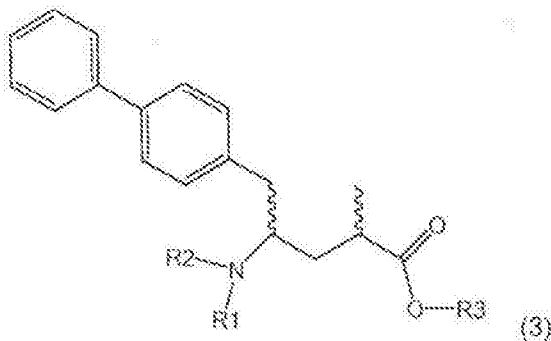
a) dobava spoja u skladu sa sljedećom formulom (1) ili njegove soli:



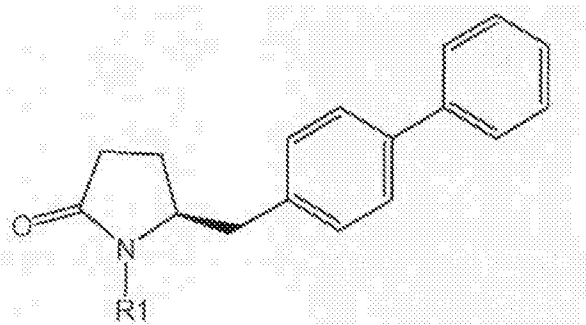
- 15 b) metilacija spoja prema formuli (1) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (2) ili njegova sol:



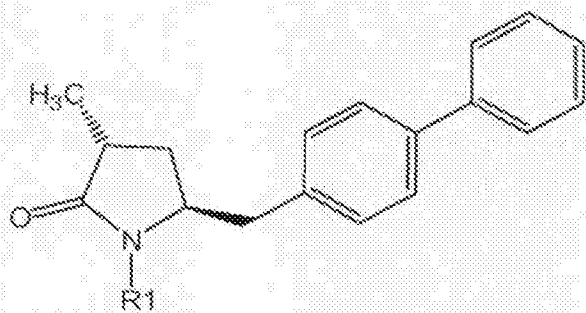
c) reakcija spoja prema formuli (2) ili njegove soli, sa sredstvom za otvaranje prstena, kako bi se dobio spoj u skladu sa sljedećom formulom (3) ili njegova sol:



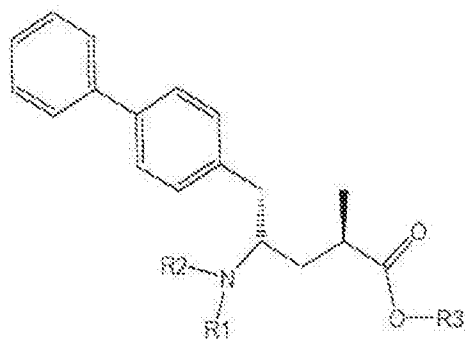
- 5 d) reakcija spoja prema formuli (3) ili njegove soli, kako bi se dobio spoj u skladu s formulom (18) ili njegova sol, pri čemu u gornjim formulama, R1 i R2 su međusobno neovisno vodikova ili dušikova zaštitna skupina i R3 je vodik ili alkil.
75. Postupak prema zahtjevu 74, **naznačen time, da** se spoj formule (1) ili njegova sol, proizvodi u skladu s postupkom koji je definiran u bilo kojem do zahtjeva 22, 23, 31, 33, 39, 41, 43, 45, 46, 47, 48, 49 ili 69.
- 10 76. Postupak prema zahtjevu 74, **naznačen time, da** se
- spoj formule (1) ili njegova sol, proizvodi u skladu s postupkom koji je definiran u bilo kojem do zahtjeva 22, 23, 31, 33, 39, 41, 43, 45, 46, 47, 48, 49 ili 69, i
  - spoj formule (2) ili njegova sol, proizvodi u skladu s bilo kojim od zahtjeva 8 do 16.
- 15 77. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 74 do 76, **naznačen time, da** je konfiguracija spojeva s formulama (1), (2) i (3), ili njihovih soli, u skladu sa sljedećim formulama (1-a), (2-a) i (3-a):



(1-a)



(2-a)



(3-a)

78. Spoj prema zahtjevu 60, **naznačen time**, daje u kristalnom obliku.