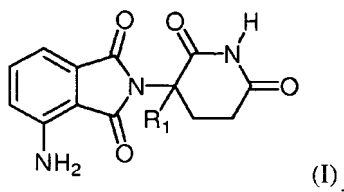


PATENTNI ZAHTJEVI

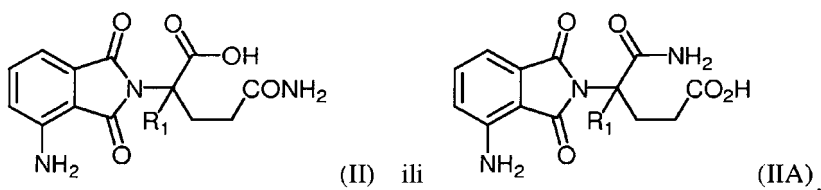
5

1. Postupak dobivanja spoja Formule (I):



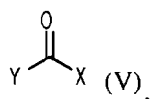
10

ili njegove farmaceutski prihvatljive soli, solvata, polimorfa ili stereoizomera, **naznačen time** što se sastoji u koraku cikliziranja spoja Formule (II) ili (IIA):



15

ili njegove soli s ciklizirajućim sredstvom Formule (V):

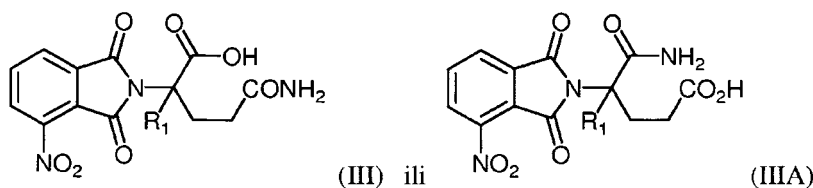


gdje je R¹ H, F, benzil, (C₁-C₈)alkil, (C₂-C₈)alkenil ili (C₂-C₈)alkinil; a svaki od X i Y je neovisno nesupstituirani ili supstituirani imidazolil, benzimidazolil ili benzotriazolil.

20

2. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je spoj Formule (I) solvat koji je hidrat.
3. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je ciklizirajuće sredstvo spoj karbonildiimidazola, po mogućnosti 1,1'-karbonildiimidazol, poželjnije gdje je omjer između spoja Formule (II) ili (IIA) i 1,1'-karbonildiimidazola od otprilike 1:1 do otprilike 1:1,2.
4. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je ciklizirajuće sredstvo 1,1'-karbonildiimidazol, te što se korak cikliziranja provodi u otapalu, po mogućnosti u acetonitrilu ili *N*-metilpirolidinonu.
5. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što je otapalo acetonitril, a temperatura reakcije je od otprilike 80 °C do otprilike 87 °C, a po mogućnosti je trajanje reakcije od otprilike 1 sat do otprilike 5 sati.
6. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što se spoj Formule (II) ili (IIA) dobiva reduciranjem spoja Formule (III) odnosno (IIIA):

30

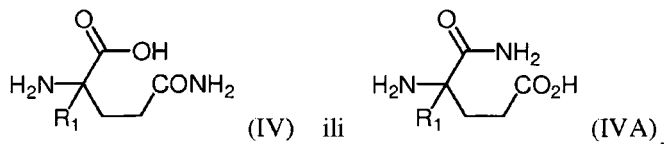


reducensom, gdje je R¹ H, F, benzil, (C₁-C₈)alkil, (C₂-C₈)alkenil ili (C₂-C₈)alkinil.

35

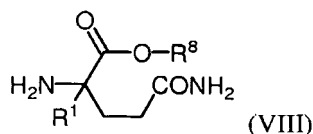
7. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 6, **naznačen time** što je reducens vodik uz 10% Pd/C; gdje je vodik izborno pod tlakom od otprilike 2,76 bar (276 kPa) do otprilike 3,45 bar (345 kPa), ili se reakciju provodi u otapalu, po mogućnosti u metanolu.
8. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 6, **naznačen time** što se spoj Formule (III) ili (IIIA) dobiva reakcijom 3-nitroftalanhidrida sa spojem Formule (IV) odnosno (IVA):

40

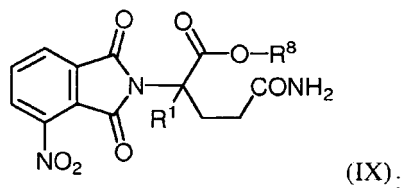


gdje je R^1 H, F, benzil, (C_1-C_8) alkil, (C_2-C_8) alkenil ili (C_2-C_8) alkinil.

9. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što se reakciju provodi u otapalu, gdje je po mogućnosti otapalo dimetilformamid, ili je temperatura reakcije od otprilike 80 °C do otprilike 87 °C.
10. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je spoj Formule (I) slobodni amin; gdje postupak izborno dodatno uključuje korak reakcije slobodnog amina s kiselinom, po mogućnosti klorovodičnom kiselinom, u molarnom omjeru od otprilike 1:1, kako bi se dobilo sol s kiselinom.
11. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 6, **naznačen time** što se spoj Formule (III) dobiva u koracima:
 - (a) reakcije 3-nitro-*N*-etoksikarbonilftalimida s esterom glutamina Formule (VIII):



ili njegovom solju s kiselinom, u prisutnosti prvog katalizatora, kako bi se dobilo spoj Formule (IX) ili njegovu sol, solvat, polimorf ili stereoisomer:



- i
- (b) reakcije spoja Formule (IX) ili njegove solu, solvata, polimorfa ili stereoisomera s klorovodikom, gdje je R^1 H, F, benzil, (C_1-C_8) alkil, (C_2-C_8) alkenil ili (C_2-C_8) alkinil; a R^8 je alkil ili aralkil.
12. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što dodatno uključuje korak dobivanja 3-nitro-*N*-etoksikarbonilftalimida reakcijom 3-nitroftalimida s etil-klorformijatom, u prisutnosti drugog katalizatora, gdje je po mogućnosti i prvi katalizator i drugi katalizator trietilamin.
13. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 12, **naznačen time** što je R^1 H; a R^8 je *t*-butil ili benzil; ili gdje je spoj Formule (VIII) hidroklorid *t*-butilnog estera L-glutamina, a spoj Formule (III) je (*S*)-enantiomer; ili gdje je spoj Formule (VIII) hidroklorid *t*-butilnog estera D-glutamina, a spoj Formule (III) je (*R*)-enantiomer; ili gdje je spoj Formule (VIII) racemična smjesa hidroklorida *t*-butilnog estera glutamina, a spoj Formule (III) je racemična smjesa.
14. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, 6 ili 8, **naznačen time** što je R^1 H.
15. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je spoj Formule (I) racemična smjesa, (+)-enantiomer ili (–)-enantiomer.
16. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 14, **naznačen time** što dodatno uključuje korak prekrizaliziranja spoja Formule (I) iz smjese otapala koja se sastoji od dimetil-sulfoksida i vode.
17. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 16, **naznačen time** što je omjer između dimetil-sulfoksida i vode od 1:10 do 10:1, volumno, ili od 1:4 do 1:8, volumno.