

(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  
25. November 2021 (25.11.2021)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2021/233783 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation:  
C07D 217/26 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2021/062837

(22) Internationales Anmeldedatum:  
14. Mai 2021 (14.05.2021)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
20175721.8 20. Mai 2020 (20.05.2020) EP

(71) Anmelder: **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT**  
[DE/DE]; Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen  
(DE). **BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT**  
[DE/DE]; Müllerstr. 178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder: **FEY, Peter**; Am Eickhof 23, 42111 Wuppertal  
(DE). **NOWAKOWSKI, Marc**; Zum Lohbusch 13, 42111  
Wuppertal (DE). **EGGER, Julian**; Anton-Küppers-Weg  
15, 42855 Remscheid (DE). **BREMEYER, Nadine**; Xan-  
tener Strasse 6, 40474 Düsseldorf (DE).

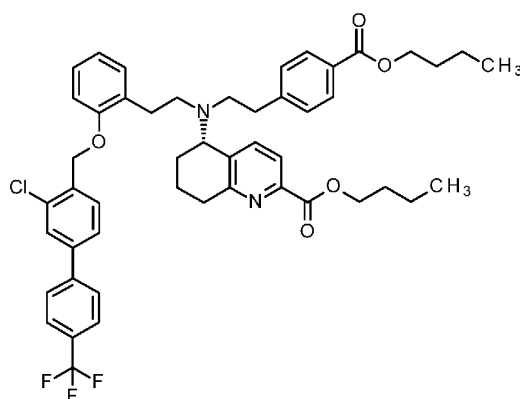
(74) Anwalt: **BIP PATENTS**; Alfred-Nobel-Str. 10, 40789  
Monheim am Rhein NRW (DE).

(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, 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,

(54) Title: PROCESS OF PREPARING BUTYL-(5S)-5-({2-[4-(BUTOXYCARBONYL)PHENYL]ETHYL}[2-(2-{[3-CHLORO-4'-(TRIFLUOROMETHYL)]BIPHENYL]-4-YL]METHOXY}PHENYL)ETHYL]AMINO)-5,6,7,8-T  
ETRAHYDROQUINOLINE-2-CARBOXYLATE

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON BUTYL-(5S)-5-({2-[4-(BUTOXYCARBONYL)PHENYL]ETHYL}[2-(2-{[3-CHLOR-4'-(TRIFLUORMETHYL)]BIPHENYL]-4-YL]METHOXY}PHENYL)ETHYL]AMINO)-5,  
6,7,8-TETRAHYDROCHINOLIN-2-CARBOXYLAT



(XII)

(57) Abstract: The invention relates to a new and improved process of preparing butyl-(5S)-5-({2-[4-(butoxycarbonyl)phenyl]ethyl}[2-(2-{[3-chloro-4'-(trifluoromethyl)]biphenyl]-4-yl]methoxy}phenyl)ethyl]amino)-5,6,7,8-tetrahydroquinoline-2-carboxylate of formula (XII), new precursors for its preparation, and to its use for preparing (5S)-5-({2-[4-(butoxycarbonyl)phenyl]ethyl}[2-(2-{[3-chloro-4'-(trifluoromethyl)]biphenyl]-4-yl]methoxy}phenyl)ethyl]amino)-5,6,7,8-tetrahydroquinoline-2-carboxylic acid.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft ein neues und verbessertes Verfahren zur Herstellung von Butyl-(5S)-5-({2-[4-(butoxycarbonyl)phenyl]ethyl}[2-(2-{[3-chlor-4'-(trifluormethyl)]biphenyl]-4-yl]methoxy}phenyl)ethyl]amino)-5,6,7,8-tetrahydrochinolin-2-carboxylat der Formel (XII) neue Vorstufen zu deren Herstellung, sowie die Verwendung zur Herstellung von (5S)-5-({2-[4-(butoxycarbonyl)phenyl]ethyl}[2-(2-{[3-chlor-4'-(trifluormethyl)]biphenyl]-4-yl]methoxy}phenyl)ethyl]amino)-5,6,7,8-tetrahydrochinolin-2-carbonsäure.

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]



WO 2021/233783 A1

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)*