



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2340252 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 317/44 (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21) Translation Published 2016.03.14

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2015.11.11

(86) European Application Nr. 09813307.7

(86) European Filing Date 2009.09.08

(87) The European Application's Publication Date 2011.07.06

(30) Priority 2008.09.09, US, 95341 P

(84) Designated Contracting States: AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO SE SI SK SM TR

(73) Proprietor AstraZeneca AB, , 151 85 Södertälje, SE-Sverige

(72) Inventor AUFDENBLATTEN, Rhony, Lonza AG Walliser WerkeLonzastr., CH-3930 Visp, CH-Sveits
BOHLIN, Martin, Hans, c/o AstraZeneca Intellectual Property,AstraZeneca, Alderley Park,Macclesfield, Cheshire,SK10 4TG, GB-Storbritannia
HELLSTRÖM, Helena, c/O AstraZeneca Intellectual Property,Astra Zeneca, Alderley Park,Macclesfield, Cheshire,SK10 4TG, GB-Storbritannia
JOHANSSON, Peter, W, C/O AstraZeneca Intellectual Property,AstraZeneca, Alderley Park,Macclesfield, Cheshire,SK10 4TG, GB-Storbritannia
LARSSON, Ulf, G, C/O AstraZeneca Intellectual Property,AstraZeneca, Alderley Park,Macclesfield, Cheshire,SK10 4TG, GB-Storbritannia
RECKNAGEL, Mikaela, AstraZeneca R&D Södertälje, S-151 85 Södertälje, SE-Sverige
WEISS, Ursula, heiress of WEISS Andreas (Deceased), An der Tennerri, CH-3939 Eggerberg, CH-Sveits

(74) Agent or Attorney Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

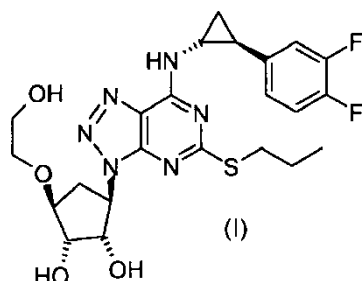
(54) Title **A PROCESS FOR PREPARING [1S-J1-ALPHA, 2-ALPHA, 3-BETA (1S*,2R*)5-BETA]]-3-[7-[2-(3,4-DIF LUOROPHENYL)-CYCLOPROPYLAMINO]-5-(PROPYLTHIO)-3H-1,2,3-TRIAZOLO[4,5-D]PYRIMIDIN-3-YL]-5-(2-HYDROXYETHOXY)CYCLOPENTANE-1,2-DIOL AND TO ITS INTERMEDIATES**

(56) References Cited: EP-A2- 0 434 450
WO-A1-00/34283
WO-A1-01/92263
WO-A2-02/091988
WO-A2-2005/073213
BRIAN SPRINTHORPE ET AL.: 'From ATP to AZD6140: The discovery of an orally active reversible P2Y12 receptor antagonist for the prevention of thrombosis' BIOORGANIC MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS vol. 17, 2007, pages 6013 - 6018, XP022267216

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

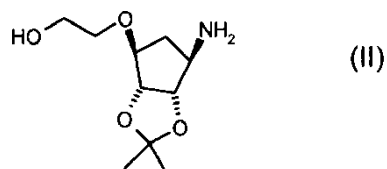
Patentkrav

1. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse med formel (I)

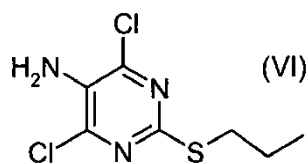


5
omfattende

(a) omsetning av en forbindelse med formel (II)

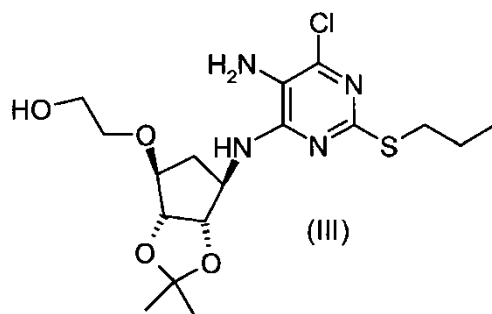


10 med oksalsyre for å danne oksalatsaltet av forbindelsen med formel (II), hvor
reaksjonen blir utført i etanol eller i en blanding av vann og etanol, hvoretter iso-
propylacetat tilsettes til reaksjonsblandingen; og
(b) omsetning av saltet av forbindelsen med formel (II) med et overskudd av en
15 forbindelse med
formel (VI)



i nærvær av trietylamin ved mellom 80 °C og 115 °C i en oksygenkonsentrasjon
under 0,5 volum% for å oppnå forbindelsen med formel (III)

20

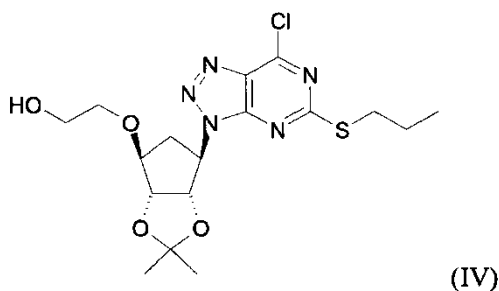


og isolering av forbindelsen med formel (III) i krystallinsk form;

og

(c) omsetning av forbindelsen med formel (III) med eddiksyre og natriumnitritt ved mellom 20 °C og 30 °C for å oppnå forbindelsen med formel (IV)

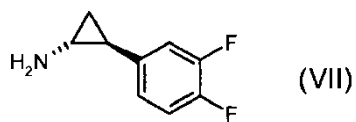
5



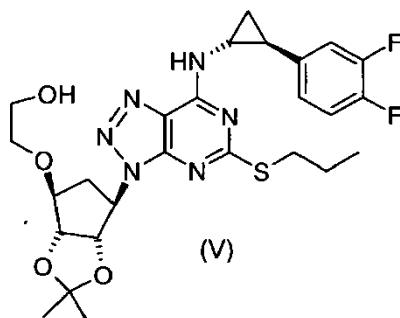
og

(d) omsetning av forbindelsen med formel (IV) med en forbindelse med formel (VII) ved en temperatur lik eller under 40 °C

10



hvorfor forbindelsen med formel (VII) blir tilsatt til reaksjonsblandingen i trinn (d) med en hastighet som holder reaksjonstemperaturen ved eller under 30 °C, for å oppnå forbindelsen med formel (V)



og

(e) å avbeskytte forbindelsen med formel (V) ved hjelp av vandig saltsyre i metanol i et to-fase-system for å oppnå forbindelsen med formel (I).

5 **2.** Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor løsningsmidlet som anvendes i trinn (b) er etanol, isopropylalkohol eller etylenglykol.

3. Fremgangsmåte ifølge krav 2, hvor løsningsmidlet som anvendes i trinn (b) er etylenglykol.

10

4. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1-3, hvor produktet fra trinn (c) anvendes i det etterfølgende reaksjonstrinn uten isolering.

5. Oksalatsaltet av forbindelsen med formel (II)

15

