



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2346845 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 311/58 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21) Translation Published 2015.08.03

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2015.03.25

(86) European Application Nr. 09751854.2

(86) European Filing Date 2009.10.28

(87) The European Application's Publication Date 2011.07.27

(30) Priority 2008.10.31, IT, MI20081924

(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 ZaCh System S.p.A., Via Lillo del Duca, 10, 20091 Bresso (Milano), IT-Italia

(72) Inventor MARAGNI, Paolo, Via Grioli 32, I-46030 Virgilio (MN), IT-Italia
MICHIELETTO, Ivan, Via S. Polo 2542, I-30125 Venezia, IT-Italia
VOLPICELLI, Raffaella, Via Nino Bixio 23, I-36100 Vicenza, IT-Italia
SORIATO, Giorgio, Via delle Terme 22, I-37042 Caldiero (Verona), IT-Italia
FOLETTTO, Johnny, Via Molinazzo 34/a, I-37040 Arcole (Verona), IT-Italia
COTARCA, Livius, Via Mercato 18, I-33052 Cervignano del Friuli (Udine), IT-Italia
VERZINI, Massimo, Via Terme 10, I-37042 Caldiero (Verona), IT-Italia

(74) Agent or Attorney Plougmann & Vingtoft, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

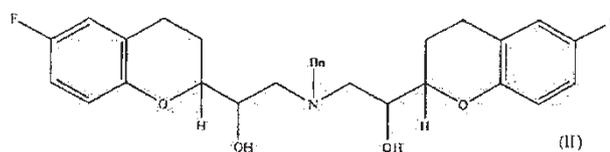
(54) Title **Process for preparing nebigivolol**

(56) References Cited: WO-A-2004/041805
WO-A-2008/064827

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 debenzylering av en forbindelse med formel (II)



som omfatter omsetning av nevnte forbindelse med maursyre i nærvær av en palladium-basert katalysator;
 karakterisert ved at debenzyleringen utføres i nærvær av sek-butanol.

2. Fremgangsmåte ifølge krav 1, karakterisert ved at katalysatoren er Pd/C.

3. Fremgangsmåte ifølge krav 2, karakterisert ved at katalysatoren er en våt-type Pd/C.

4. Fremgangsmåte ifølge krav 2, karakterisert ved at katalysatoren er 5 vekt% Pd/C.

5. Fremgangsmåte ifølge krav 1, karakterisert ved at katalysatoren anvendes i en mengde som utgjør 2-10 vekt% i forhold til substratet.

6. Fremgangsmåte ifølge krav 1, karakterisert ved at debenzyleringen utføres ved en temperatur rundt 70 °C.

7. Fremgangsmåte ifølge krav 1, karakterisert ved at det molare forhold mellom maursyre/substrat er 3:1.

8. Fremgangsmåte for syntese av nebivolol eller et addisjonssalt derav, som omfatter debenzylering av en forbindelse med formel II med maursyre i nærvær av en palladium-basert katalysator som angitt i krav 1.

9. Fremgangsmåte ifølge et av de foregående krav, karakterisert ved at en forbindelse med formel II er til stede i form av en racemisk blanding (\pm)[R*, S*, S*, S*].

10. Fremgangsmåte for syntese av nebivolol eller et addisjonssalt derav med en renhet på minst 99,9 vekt%, som omfatter en debenzylering ifølge krav 1.

11. Fremgangsmåte for syntese av nebivolol eller et addisjonssalt derav, inneholdende mindre enn 0,1 vekt % "de-F" nebivolol, som omfatter en debenzylering ifølge krav 1.