



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2609923 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

**A61K 31/7076 (2006.01)**

**A61P 31/14 (2006.01)**

**C07F 7/18 (2006.01)**

**C07F 9/24 (2006.01)**

**C07F 9/655 (2006.01)**

**C07F 9/6558 (2006.01)**

**C07F 9/6561 (2006.01)**

**C07H 19/04 (2006.01)**

**C07H 19/044 (2006.01)**

**C07H 19/052 (2006.01)**

**C07H 19/06 (2006.01)**

**C07H 19/10 (2006.01)**

**C07H 19/20 (2006.01)**

**C07H 19/207 (2006.01)**

**C07H 19/24 (2006.01)**

Norwegian Industrial Property Office

---

- (21) Translation Published 2017.10.30
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2017.05.24
- (86) European Application Nr. 13159791.6
- (86) European Filing Date 2011.03.31
- (87) The European Application's Publication Date 2013.07.03
- (30) Priority 2010.03.31, US, 319513 P  
2010.03.31, US, 319548 P  
2010.05.20, US, 783680
- (84) Designated Contracting States: AL 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 RS SE SI SK SM TR
- Designated Extension States: BA ME
- (62) Divided application EP2552930, med inndato 2011.03.31
- (73) Proprietor Gilead Pharmasset LLC, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA
- (72) Inventor Ross, Bruce S., 155 Del Monte Rd., El Granada, CA 94018, US-USA  
Sofia, Michael Joseph, 3066 Antler Drive, Doylestown, PA 18902, US-USA  
Pamulapati, Ganapati Reddy, 1709 Blakesley Drive, San Ramon, CA 94582, US-USA  
Rachakonda, Suguna, 1272 Sharonbrook Drive, Twinsburg, OH 44087, US-USA  
Zhang, Hai-Ren, 6767 Mason Way, San Jose, CA 95129, US-USA  
Chun, Byoung-Kwon, 135 Heritage Street, Robbinsville, NJ 08691, US-USA  
Wang, Peiyuan, 42 Continental Circle, Totowa, NJ 07512, US-USA
- (74) Agent or Attorney Tandberg Innovation AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge
- 

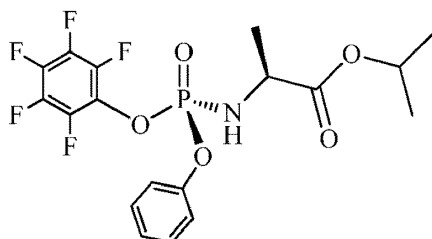
(54) Title **PROCESS FOR THE CRYSTALLISATION OF (S)-ISOPROPYL 2-(((S)-(PERFLUOROPHENOXY)(PHENOXY)PHOSPHORYL)AMINO)PROPANOATE**

(56) References Cited: WO-A1-2010/135569  
WO-A1-2011/123672  
WO-A2-2008/121634

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.** En fremgangsmåte for fremstilling av krystallinsk (S)-isopropyl 2-(((S)-(perfluorfenoksy)(fenoksy)fosforyl)amino)propanoat representert ved formelen



som omfatter:

krystallisering av (S)-isopropyl 2-(((S)-(perfluorfenoksy)(fenoksy)fosforyl)-amino)propanoat fra en andre sammensetning omfattende

- a) en første sammensetning;
- b) pentafluorfenol;
- c) en ikke-nukleofil base; og
- d) en flytende sammensetning;

hvor den første sammensetningen omfatter (S)-isopropyl 2-(((S)-(perfluorfenoksy)-(fenoksy)fosforyl)amino)propanoat og (S)-isopropyl-2-(((R)-(perfluorfenoksy)(fenoksy)-fosforyl)amino)propanoat, og hvor den flytende sammensetningen omfatter minst én av et løsningsmiddel og et anti-løsningsmiddel.

**2.** Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor krystalliseringen skjer ved en temperatur som spenner fra -10 °C til +40 °C.

**3.** Fremgangsmåte ifølge krav 2, hvor krystalliseringen skjer ved temperatur.

**4.** Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor den ikke-nukleofile base er valgt blant kaliumkarbonat, cesiumkarbonat, di-isopropylamin, diisopropyletylamin, trietylamin, kinuklidin, naftalen-1,8-diamin, 2,2,6,6-tetrametylpiiperidin, 1,8-diazabicykloundec-7-en, 4-dimetylamino-pyridin, pyridin, et 2,6-di-C<sub>1-6</sub>-alkyl-pyridin, et 2,4,6-tri-C<sub>1-6</sub>-alkyl-pyridin, 1,5-diazabicyklo[4.3.0]non-5-en, 1,4-diazabicyklo[2.2.2]oktan, og blandinger derav.

**5.** Fremgangsmåte ifølge krav 4, hvor den ikke-nukleofile base er trietylamin.

**6.** Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor den flytende sammensetningen omfatter minst én av en C<sub>2</sub>- til C<sub>8</sub>-eter, en C<sub>3</sub>- til C<sub>7</sub>-ester og et C<sub>5</sub>- til C<sub>12</sub>-mettet hydrokarbon.

5

**7.** Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor den flytende sammensetningen omfatter minst én av etylacetat, t-butyl-metyleter og heksan.