



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3105220 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

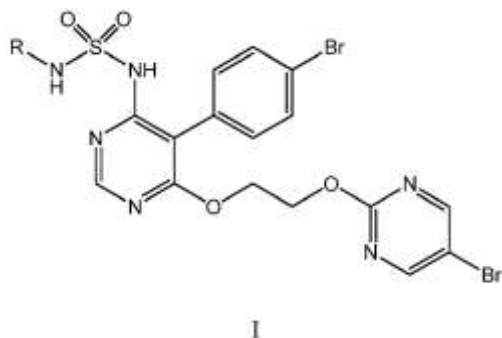
(45)	Translation Published	2020.09.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.07.01
(86)	European Application Nr.	15706185.4
(86)	European Filing Date	2015.02.13
(87)	The European Application's Publication Date	2016.12.21
(30)	Priority	2014.02.14, EP, 14155137
(84)	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
(73)	Proprietor	Idorsia Pharmaceuticals Ltd, Heggenheimermattweg 91, 4123 Allschwil, Sveits
(72)	Inventor	ABELE, Stefan, c/o Actelion Pharmaceuticals Ltd.Gewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, Sveits FUNEL, Jacques-Alexis, c/o Actelion Pharmaceuticals Ltd.Gewerbstrasse 16, CH- 4123 Allschwil, Sveits SCHINDELHOLZ, Ivan, c/o Actelion Pharmaceuticals Ltd.Gewerbstrasse 16, CH- 4123 Allschwil, Sveits
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	PROCESS FOR MANUFACTURING PYRIMIDINE SULFAMIDE DERIVATIVES
(56)	References Cited:	WO-A1-02/053557 WO-A1-03/055863 WO-A1-2009/024906

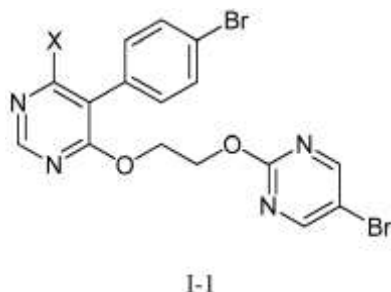
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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

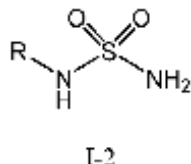
1. Fremgangsmåte for fremstilling av forbindelsen med formel I



hvor R er H, eller et salt derav, fremgangsmåten omfattende reaksjonen av forbindelsen med formel I-1



hvor X er brom, klor eller fluor, med forbindelsen med formel I-2



hvor R er H, eller et salt av forbindelsen med formel I-2, hvor reaksjonen utføres i nærvær av en base i et polart aprotisk organisk løsemiddel eller en polar blanding av aprotiske organiske løsemidler, og når X er brom eller klor, i nærvær av tetra-*n*-butylammoniumfluoridhydrat eller cesiumfluorid.

2. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvor basen velges fra gruppen som består av NaOH, KOH, 1,8-diazabicyklo[5.4.0]undek-7-en, trietylamin, kalium-tert-butylat, Na₂CO₃ K₂CO₃ og Cs₂CO₃.

3. Fremgangsmåten ifølge krav 2, hvor basen er K₂CO₃.

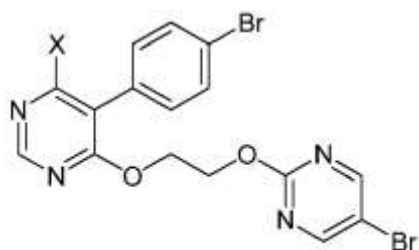
4. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor det polare aprotiske organiske løsemidlet eller den polare blandingen av aprotiske organiske

løsemidler omfatter dimetylsulfoksid.

5. Fremgangsmåten ifølge krav 4, som utføres ved hjelp av dimetylsulfoksid som løsemiddel.

6. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori X er klor, og reaksjonen av forbindelsen med formel I-1 med forbindelsen med formel I-2 utføres i nærvær av tetra-*n*-butylammoniumfluoridhydrat og ved anvendelse av dimetylsulfoksid som løsemiddel.

7. Forbindelse med formel I-1



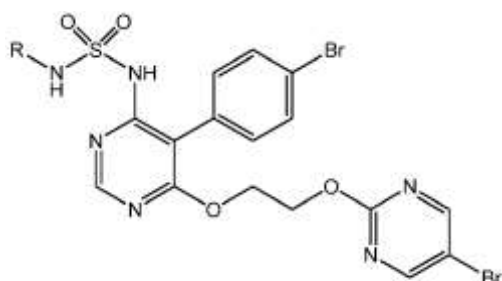
I-1

hvori X er fluor;

eller et salt av forbindelsen.

8. Anvendelse av en forbindelse med formel I-1 ifølge krav 7, eller av et salt derav, i en fremgangsmåte for fremstilling av forbindelsen med formel I som definert i krav 1, eller et salt derav.

9. Fremgangsmåte for fremstilling av forbindelsen med formel I



I

hvori R er H, eller for fremstilling av et salt derav, fremgangsmåten omfattende de følgende trinnene:

a) reaksjonen av forbindelsen med formel I-1_{C1}

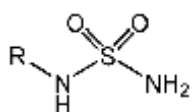
I-1_{C1}

eller et salt derav, med tetra-*n*-butylammoniumfluoridhydrat eller cesiumfluorid i nærvær av en base i et polart aprotisk organisk løsemiddel eller en polar blanding av aprotiske organiske løsemidler, for å gi forbindelsen med formel I-1_F

I-1_F

og

b) reaksjonen av forbindelsen med formel I-1_F oppnådd i trinn a) med en forbindelse med formel I-2



I-2

hvor R er H, eller et salt derav, i nærvær av en base i et polart aprotisk organisk løsemiddel eller en polar blanding av aprotiske organiske løsemidler, for å gi forbindelsen med formel I eller et salt derav.

10. Fremgangsmåten ifølge krav 9, hvor trinn a) utføres ved å reagere forbindelsen med formel I-1_{C1} med cesiumfluorid.