



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3237404 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 233/56 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.03.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.11.11
(86)	European Application Nr.	15830935.1
(86)	European Filing Date	2015.12.22
(87)	The European Application's Publication Date	2017.11.01
(30)	Priority	2014.12.23, US, 201462096391 P 2015.12.17, US, 201562269064 P
(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
(73)	Proprietor	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(72)	Inventor	BROWN, Brandon Heath, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA CHAN, Brenda J. Burke, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA CHIU, Anna, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA GRIGGS, Nolan, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA HEUMANN, Lars V., c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA LATHROP, Stephen P., c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA REYNOLDS, Troy Evan, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA SARMA, Keshab, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA SILER, David Allen, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA THOMPSON, Andrew S., 1144 Sawmill Road, Mountainside, New Jersey 07092, USA WANG, Tao, 25 Swenson Circle, Berkeley Heights, New Jersey 07922, USA NOTTE, Gregory, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA

(74) Agent or Attorney OSLO PATENTKONTOR AS, Hoffsvæien 1A, 0275 OSLO, Norge

(54) Title **PROCESSES FOR PREPARING ASK1 INHIBITORS**

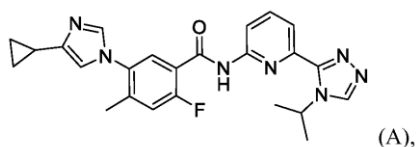
(56) References

Cited: US-A1- 2013 197 037
US-A1- 2011 009 410

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

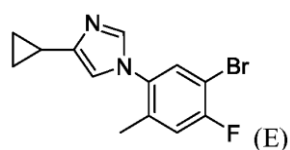
1. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse av formel (A):



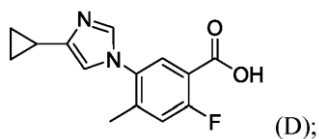
eller et salt eller solvat derav,

5 omfattende trinnene av:

(a) karboksylering av en forbindelse av formel (E) eller et salt derav:

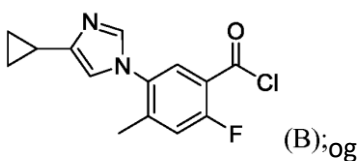


under reaksjonsbetingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse av formel (D) eller et hydrat, solvat eller salt derav:

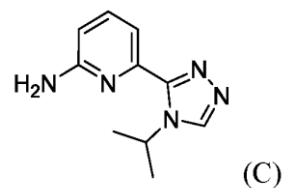


10

(b) klorinering av en forbindelse av formel (D) eller et hydrat, solvat eller salt derav under reaksjonsbetingelser som er tilstrekkelige til å danne en forbindelse av formel (B) eller et salt derav:



15 (c) sette forbindelsen av formel (B) eller et salt derav i kontakt med en forbindelse av formel (C) eller et salt derav:



under reaksjonsbetingelser som er tilstrekkelige til å gi en forbindelse av formel (A).

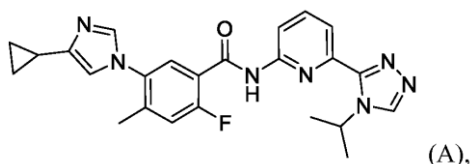
2. Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor reaksjonsbetingelsene i trinn (a) omfatter en base.

3. Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor reaksjonsbetingelsene i trinn (a) omfatter et oppløsningsmiddel valgt fra gruppen bestående av tetrahydrofuran, 2-metyltetrahydrofuran, metyl-tert-butyl eter og dietyleter.

4. Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor reaksjonsbetingelsene i trinn (a) omfatter en første temperatur på omkring -20°C til omkring 40°C og en andre temperatur på omkring -10°C til omkring 50°C .

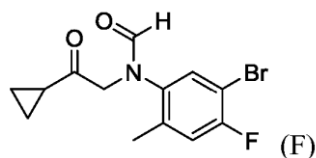
5. Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor reaksjonsbetingelsene i trinn (b) omfatter et oppløsningsmiddel valgt fra gruppen bestående av diklormetan, acetonitril, tetrahydrofuran, metyl-tert-butyleter og kloroform.

6. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse av Formel (A):

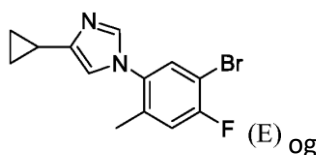


Eller et salt eller solvat derav omfattende trinnene av:

(a) å cyclisere en forbindelse av formel (F):

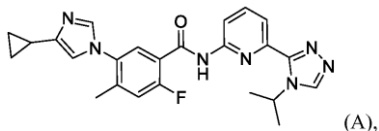


under reaksjonsbetingelser som er tilstrekkelige til å danne en forbindelse av formel (E) eller et salt derav:



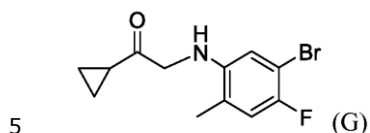
utføre en fremgangsmåte ifølge krav 1 for å gi en forbindelse av formel (A).

7. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse av formel (A):

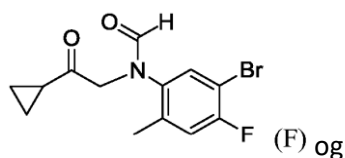


Eller et salt eller solvat derav,
omfattende trinnene av:

(a) å formulere en forbindelse av formel (G):

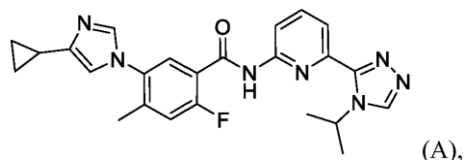


under reaksjonsbetingelser som er tilstrekkelige til å danne en forbindelse av formel (F):



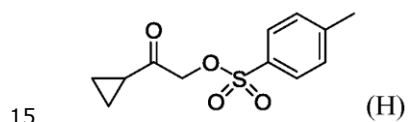
(b) utføre en fremgangsmåte ifølge krav 6 for å gi en forbindelse av formel (A).

10 8. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse av formel (A):

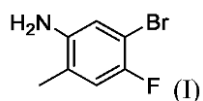


eller et salt eller solvat derav
omfattende trinnene av:

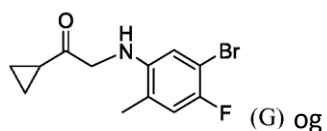
(a) å sette en forbindelse av formel (H):



i kontakt med en forbindelse av formel (I):

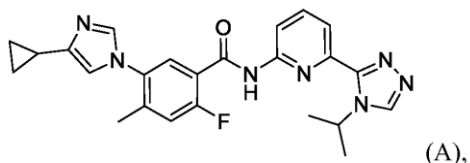


under reaksjonsbetingelser som er tilstrekkelige til å danne en forbindelse av formel (G):



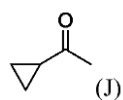
(b) utføre en fremgangsmåte ifølge krav 7 for å gi en forbindelse av formel (A).

9. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse av formel (A):

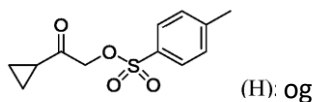


5 eller et salt eller solvat derav,
omfattende trinnene av:

(a) tosyloksylere en forbindelse av formel (J):



10 under reaksjonsbetingelser som er tilstrekkelige til å danne en forbindelse av
formel (H):



(b) utføre en fremgangsmåte ifølge krav 8 for å gi en forbindelse av formel (A).