(12) **Translation of European patent specification**

(11) **NO/EP 3378850 B1**

(19) NO

NORWAY

(51) Int Cl.
C07C 315/00 (2006.01)
C07C 315/04 (2006.01)
C07C 317/24 (2006.01)
C07C 317/28 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.04.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.01.08
(86)	European Application Nr.	18168969.6
(86)	European Filing Date	2013.02.20
(87)	The European Application's Publication Date	2018.09.26
(30)	Priority	2012.02.21, US, 201261601226 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
(73)	Proprietor	Amgen (Europe) GmbH, Floor 6-8 Suurstoffi 22, 6343 Risch-Rotkreuz, Sveits
(72)	Inventor	VENKATESWARALU, Jasti, Road No 22bPlot No 396 Jubilee Hills, 500033 Hyderabad, India RAJENDIRAN, Chinnapillai, 103 Balaji Residency 89a Vengalrao Nagar, 500038 Hyderabad, India REDDY, Nallamaddi Ravikumar, 16-2-146/5/2402 Anusuya Residency Malakpet, 500036 Hyderabad, India CONNOLLY, Terrence Joseph, 104 Wawayanda Road, Warwick, NY 10990, USA RUCHELMAN, Alexander L., 15 Cutter Court, Cream Ridge, NJ 08514, USA ECKERT, Jeffrey, 13 West Susan Street, Hazlet, NJ 07730, USA FRANK, Anthony Joseph, 139 Clover Hollow Road, Easton, PA 18045, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **PROCESSES FOR THE PREPARATION OF (S)-1-(3-ETHOXY-4METHOXYPHENYL)-2-METHANESULFONYLETHYLAMINE**

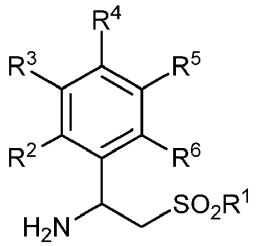
(56) References Cited:

WO-A2-2010/030345
US-A1- 2010 324 108
FRANCISCO VELÁZQUEZ ET AL: "Steroselective synthesis of beta-substituted beta-amino sulfones and sulfonamides via addition of sulfonyl anions to chiral N-sulfinyl imines", ORGANIC LETTERS , 14(23), 6012-6015 CODEN: ORLEF7; ISSN: 1523-7052, , vol. 8, no. 4 1 January 2006 (2006-01-01), pages 789-792, XP002712270, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/OL053132B

Retrieved from the Internet: URL:http://pubs.acs.org/doi/abs/10.1021/ol 053132b [retrieved on 2006-01-19] HUA ZHANG ET AL: "Practical and stereoselective synthesis of beta-amino sulfones from alkylphenylsulfones and N-(tert-butylsulfinyl)aldimines", JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, CHEMICAL SOCIETY, LETCHWORTH; GB , vol. 9 1 January 2011 (2011-01-01), pages 6502-6505, XP002712271, ISSN: 0368-1769, DOI: 10.1039/C1OB05992K Retrieved from the Internet: URL:http://pubs.rsc.org/en/content/article pdf/2011/ob/c1ob05992k [retrieved on 2011-08-02]

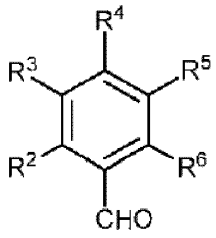
Patentkrav

1. Fremgangsmåte for å fremstille en forbindelse med formel (II):



(II)

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrat, solvat eller polymorf derav,
som omfatter:
(a) kondensere et kiralt hjelpestoff med et aldehyd som har formelen



,

hvori det kirale hjelpestoffet er (R)-(+)-tertiært butylsulfinamid eller
(S)-α-metylbenzylamin;
(b) tilsette et nukleofil til det kondenserte produktet, hvori nukleofilet er litiumanionet av dimetylsulfon; og
(c) avbeskytte tilleggsproduktet,
hvori:
R^1 er CH_3; og
hver av R^2, R^3, R^4, R^5 og R^6 ved hver forekomst er uavhengig hydrogen, halogen, C_1-C_6alkyl, C_1-C_6alkoksy, $-CF_3$, -CN eller $-NO_2$.

2. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori R^1 er $-CH_3$; R^2 er H; R^3 er H; R^4 er $-OCH_3$; R^5 er $-OCH_2CH_3$; og R^6 er H.

3. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori tilsetningen av et nukleofil skjer under basisk tilstand.

4. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori avbeskyttelse av tilsetningsproduktet skjer under sur tilstand.

5. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori aldehydet er 3-etoksy-4-metoksybenzaldehyd.

6. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori det kirale hjelpestoffet er (R)-(+)-tertiært butylsulfinamid.

7. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori det kirale hjelpestoffet er (S)-α-metylbenzylamin.

8. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori aldehydet er 3-etoksy-4-metoksybenzaldehyd, det kirale hjelpestoffet er (R)-(+)-tertiært butylsulfinamid eller (S)-α-metylbenzylamin, og nukleofilet er litiumanionet av dimetylsulfon.