



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3589636 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 309/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.12.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.09.13
(86)	European Application Nr.	18712343.5
(86)	European Filing Date	2018.03.02
(87)	The European Application's Publication Date	2020.01.08
(30)	Priority	2017.03.03, US, 201762466915 P 2017.09.01, US, 201762553300 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	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(72)	Inventor	GEIER, Michael, c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA HUMPHREYS, Luke, c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA IKEMOTO, Norihiro, c/o J-STAR Research Inc. 3001 Hadley Road Units 1-5A, South Plainfield, New Jersey 07080, USA LIEW, Sean, c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA MORRISON, Henry, c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA SCOTT, Mark E., c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA VARGHESE, Vimal, c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA
(74)	Agent or Attorney	AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge

(54) Title **PROCESSES FOR PREPARING ACC INHIBITORS AND SOLID FORMS THEREOF**

(56) References
Cited: US-A1- 2013 123 231
WO-A1-2017/151816
EMERSON T R ET AL: "743. Optical rotatory dispersion. Part XIX. A series of acids,
imidazolines, amidinium chlorides, and their copper complexes, related to mandelic acid",
JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, CHEMICAL SOCIETY, LETCHWORTH; GB, 1965,
pages 4007-4014, XP009504882, ISSN: 0368-1769, DOI: 10.1039/JR9650004007
CAIRA ED - MONTCHAMP JEAN-LUC: "Crystalline Polymorphism of Organic Compounds",
TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY; [TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY], SPRINGER,
BERLIN, DE, vol. 198, 1998, pages 163-208, XP008166276, ISSN: 0340-1022

YERRAM CHANDRAMOULI ET AL: "Review on Cocrystal as an Approach with Newer Implications in Pharmaceutical Field in International", INTERNATIONAL JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY & ANALYSIS, IN, vol. 2, no. 2, 2012, pages 91-100, XP008184747, ISSN: 2249-7595

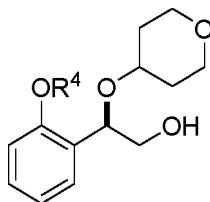
EMERSON T R ET AL: "743. Optical rotatory dispersion. Part XIX. A series of acids, imidazolines, amidinium chlorides, and their copper complexes, related to mandelic acid", JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY,, 1965, pages 4007-4014, XP009504882, ISSN: 0368-1769, DOI: 10.1039/JR9650004007

PU-CHA YAN ET AL: "Direct asymmetric hydrogenation of [alpha]-keto acids by using the highly efficient chiral spiro iridium catalysts", CHEMICAL COMMUNICATIONS, vol. 50, no. 100, 2014, pages 15987-15990, XP055436828, UK ISSN: 1359-7345, DOI: 10.1039/C4CC07643E

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

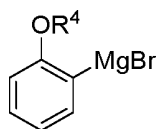
1. Fremgangsmåte ved fremstilling av en forbindelse med formel (J):



(J),

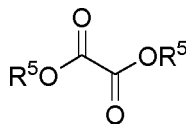
omfattende trinnene å:

5 (a) bringe en forbindelse med formel (R):



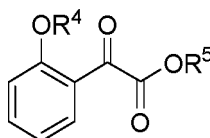
(R)

i berøring med en forbindelse med formel (S):



(S)

under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (P):

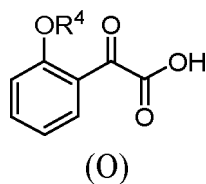


(P)

eller et solvat eller et hydrat derav,

2

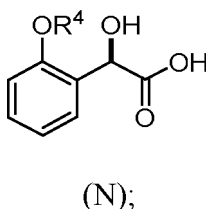
(b) bringe en forbindelse med formel (P), eller et solvat eller et hydrat derav, i berøring med en base under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (O):



5

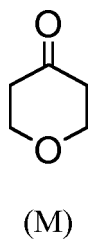
eller et salt, et solvat eller et hydrat derav,

(c) en forbindelse med formel (O), eller et salt, et solvat eller et hydrat derav, i berøring med et reduksjonsmiddel og en katalysator under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (N):

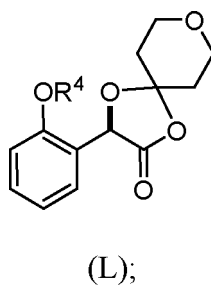


10

(d) bringe en forbindelse med formel (N) i berøring med en forbindelse med formel (M):

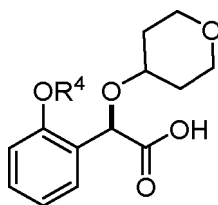


under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (L):



15

(e) bringe en forbindelse med formel (L) i berøring med et reduksjonsmiddel under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (K):

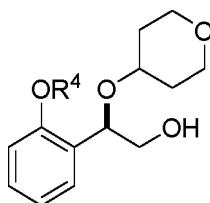


(K);

og (f) bringe en forbindelse med formel (K) i berøring med et reduksjonsmiddel under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (J);

hvor R^4 er C_{1-3} -alkyl og hver R^5 er uavhengig et valgfritt substituert C_{1-6} -alkyl eller et valgfritt substituert C_{1-6} -aryl.

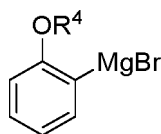
2. Fremgangsmåte ved fremstilling av forbindelse med formel (J):



(J),

10 omfattende trinnene å:

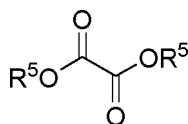
(a) bringe en forbindelse med formel (R):



(R)

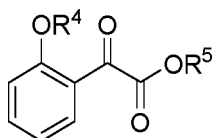
i berøring med en forbindelse med formel (S):

4



(S)

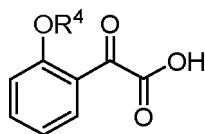
under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (P):



(P)

eller et solvat eller et hydrat derav,

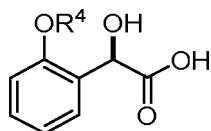
- 5 (b) bringe en forbindelse med formel (P), eller et solvat eller et hydrat derav, i berøring med en base under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (O):



(O)

eller et salt, et solvat eller et hydrat derav,

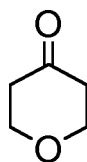
- 10 (c) bringe en forbindelse med formel (O), eller et salt, et solvat eller et hydrat derav, i berøring med et reduksjonsmiddel og en katalysator under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (N):



(N);

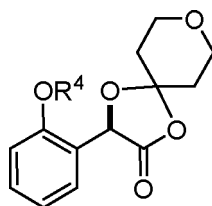
- 15 (d) bringe en forbindelse med formel (N) i berøring med en forbindelse med formel (M):

5



(M)

under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (L):



(L);

5 og (g) bringe en forbindelse med formel (L) i berøring med et reduksjonsmiddel under betingelser som er tilstrekkelige for å danne en forbindelse med formel (J),

hvor R^4 er C_{1-3} -alkyl og hver R^5 er uavhengig et valgfritt substituert C_{1-6} -alkyl eller et valgfritt substituert C_{1-6} -aryl.

3. Fremgangsmåte ifølge krav 1 eller 2, hvor R^4 er metyl.

4. Fremgangsmåte ifølge krav 1 eller 2, hvor R^5 er etyl.