

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
22. April 2021 (22.04.2021)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2021/074079 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 471/04 (2006.01) C07B 55/00 (2006.01)

TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2020/078614

(22) Internationales Anmeldedatum:

12. Oktober 2020 (12.10.2020)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

19203824.8 17. Oktober 2019 (17.10.2019) EP

(71) Anmelder: **BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT**
[DE/DE]; Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen
(DE).

(72) Erfinder: **PLATZEK, Johannes**; Grottkauer Str. 55,
12621 Berlin (DE). **LOVIS, Kai**; Jahnstr. 109A, 40215
Düsseldorf (DE).

(74) Anwalt: **BIP PATENTS**; Alfred-Nobel-Str. 10, 40789
Monheim am Rhein NRW (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY,
BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM,
DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH,
KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA,
MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI,
NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU,
RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM,

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST,
SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ,
RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ,
DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT,
LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI,
SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz
3)

(54) Title: PHOTOCHEMICAL PROCESS FOR PRODUCING (4R,4S)-4-(4-CYANO-2-METHOXYPHENYL)-5-ETHOXY-2,8-DIMETHYL-1,4-DIHYDRO-1,6-NAPHTHYRIDIN-3-CARBOXAMIDE

(54) Bezeichnung: PHOTOCHEMISCHES VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON (4R, 4S)-4-(4-CYANO-2-METHOXYPHENYL)-5-ETHOXY-2,8-DIMETHYL-1,4-DIHYDRO-1,6-NAPHTHYRIDIN-3-CARBOX-AMID

(57) Abstract: The invention relates to processes for producing racemic (4R,4S)-4-(4-cyano-2-methoxyphenyl)-5-ethoxy-2,8-dimethyl-1,4-dihydro-1,6-naphthyridin-3-carboxamide of formula (I) from the enantiomers (Ia) or (Ib); a process for producing (4S)-4-(4-cyano-2-methoxyphenyl)-5-ethoxy-2,8-dimethyl-1,4-dihydro-1,6-naphthyridin-3-carboxamide of formula (Ia); a process for producing racemic (4R,4S)-4-(4-cyano-2-methoxyphenyl)-5-ethoxy-2,8-dimethyl-1,4-dihydro-1,6-naphthyridin-3-carboxamide of formula (I) from the pyridine of formula (II). The subjects of the invention have in common the irradiation of the compound of formulas (Ia), (Ib) and/or (II) with light in a suitable solvent, or solvent mixture, in the presence of a base. The compounds of formulas (Ia), (Ib) and/or (II) are intermediate products, by-products or target compounds in the synthesis of finerenone (compound according to formula (Ia)).

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft Verfahren zur Herstellung von racemischen (4 R,4S)-4-(4-Cyano-2- methoxyphenyl)-5-ethoxy-2,8-dimethyl-1,4-dihydro-1,6-naphthyridin-3-carboxamid der Formel (I) aus den Enantiomeren (Ia) oder (Ib); ein Verfahren zur Herstellung von (4S)-4-(4- Cyano-2-methoxyphenyl)-5-ethoxy-2,8-dimethyl-1,4-dihydro-1,6-naphthyridin-3-carboxamid der Formel (Ia); ein Verfahren zur Herstellung von racemischen (4 R,4S)-4-(4-Cyano-2- methoxyphenyl)-5-ethoxy-2,8-dimethyl-1,4-dihydro-1,6-naphthyridin-3-carboxamid der Formel (I) aus dem Pyridin der Formel (II). Die Erfindungsgegenstände haben das Bestrahlen der Verbindung der Formeln (Ia), (Ib) und/oder (II) mit Licht in einem geeigneten Lösungsmittel, oder Lösungsmittelgemisch, in Anwesenheit einer Base gemein. Die Verbindungen der Formeln (Ia), (Ib) und/oder (II) sind Zwischenprodukte, Nebenprodukte oder Zielverbindungen in der Synthese von Finerenone (Verbindung nach Formel (Ia)).

WO 2021/074079 A1