(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
3. Juni 2011 (03.06.2011)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2011/064156 A2

(51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 471/04 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2010/067884

(22) Internationales Anmeldedatum:
22. November 2010 (22.11.2010)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
09177369.7 27. November 2009 (27.11.2009) EP

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE]; Müller Strasse 178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **MAIS, Franz-Josef** [DE/DE]; Otto-Hahn-Str. 164, 40591 Düsseldorf (DE). **REHSE, Joachim** [DE/DE]; Am Kloster 12, 42799 Leichlingen (DE). **JOENTGEN, Winfried** [DE/DE]; Sprengelstr. 1, 50735 Köln (DE). **SIEGEL, Konrad** [DE/DE]; Görresstr. 13, 40579 Düsseldorf (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT**; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

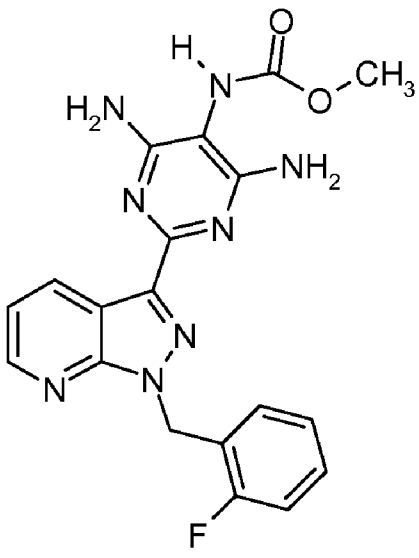
(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, 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, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) **Title**: METHOD FOR PRODUCING METHYL-{4,6-DIAMINO-2-[1-(2-FLUOROBENZYL)-1H-PYRAZOLO[3,4-B]PYRIDINO-3-YL]PYRIMIDINO-5-YL} CARBAMATE AND ITS PURIFICATION FOR USE THEREOF AS PHARMACEUTICAL SUBSTANCE

(54) **Bezeichnung** : VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON METHYL {4,6-DIAMINO-2-[1-(2-FLUOROBENZYL)-1H-PYRAZOLO[3,4-B]PYRIDIN-3-YL]PYRIMIDIN-5-YL}CARBAMAT UND DESSEN AUFREINIGUNG FÜR DIE VERWENDUNG ALS PHARMAZEUTISCHER WIRKSTOFF



(I)

(57) **Abstract**: The invention relates to a method for producing methyl-{4,6-diamino-2-[1-(2-fluorobenzyl)-1H-pyrazolo[3,4-b]pyridino-3-yl]pyrimidino-5-yl} carbamate, i.e. the compound of formula (I), and to a method for purifying the crude product of formula (I) for use as pharmaceutically active substance. For purification, methyl-{4,6-diamino-2-[1-(2-fluorobenzyl)-1H-pyrazolo[3,4-b]pyridino-3-yl]pyrimidino-5-yl}carbamate-sulfinyldimethane (1:2) of formula (II) is isolated as an intermediate or is produced as an intermediate in said purification method, optionally present in a mixture.

(57) **Zusammenfassung**: Die vorliegende Erfindung betrifft Verfahren zur Herstellung von Methyl- {4,6-diamino-2-[1-(2-fluorobenzyl)-1H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-3-yl]pyrimidin-5-yl}carbamat, d.h. der Verbindung der Formel (I) sowie ein Verfahren zur Reinigung des Rohproduktes der Formel (I) für die Verwendung als pharmazeutisch wirksamer Stoff wobei zur Reinigung Methyl- {4,6-diamino-2-[1-(2-fluorobenzyl)- 1H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-3-yl]pyrimidin-5-yl}carbamat-sulfinyldimethan (1:2) der Formel (II) als Zwischenstufe isoliert oder als Zwischenstufe in diesem Reinigungsverfahren, gegebenenfalls in einem Gemisch vorliegend, erzeugt wird.

WO 2011/064156 A2