

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la
Propriété Intellectuelle
Bureau international



WIPO | PCT



(10) Numéro de publication internationale
WO 2015/082849 A3

(43) Date de la publication internationale
11 juin 2015 (11.06.2015)

(51) Classification internationale des brevets :

C07C 45/45 (2006.01) C07C 309/66 (2006.01)
C07C 45/65 (2006.01) C07C 309/73 (2006.01)
C07C 47/575 (2006.01) C07C 233/18 (2006.01)
C07C 309/65 (2006.01) C07C 303/28 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2014/053159

(22) Date de dépôt international :

4 décembre 2014 (04.12.2014)

(25) Langue de dépôt :

français

(26) Langue de publication :

français

(30) Données relatives à la priorité :

1362200 5 décembre 2013 (05.12.2013) FR

(71) Déposant : LES LABORATOIRES SERVIER [FR/FR];
35 rue de Verdun, F-92284 Suresnes (FR).

(72) Inventeurs : BRIERE, Jean-François; 1038, rue de Mes-
nil-Esnard, F-76920 Amfreville-la-mi-voie (FR). LE-
BEUF, Raphaël; 38 rue des Meuniers, F-59000 Lille (FR).
LEVACHER, Vincent; 150, Ruette aux Cailloux, F-
76160 Fontaine-sous-preaux (FR). HARDOUIN, Chris-

tophe; 5, rue Henry Vesco, F-76310 Sainte Adresse (FR).
LÉCOUVE, Jean-Pierre; 93, rue du Docteur Vigné, F-
76600 Le Havre (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection nationale disponible) : 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, DK, DM,
DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR,
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, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ,
TZ, UG, ZM, ZW), eurasiatique (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU,
TJ, TM), européen (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).

[Suite sur la page suivante]

(54) Title : NOVEL METHOD FOR THE SYNTHESIS OF 7-METHOXY-NAPHTHALENE-1-CARBALDEHYDE AND USE THEREOF IN THE SYNTHESIS OF AGOMELATINE

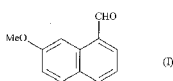
(54) Titre : NOUVEAU PROCÉDE DE SYNTHÈSE DU 7-METHOXY-NAPHTHALENE-1-CARBALDEHYDE ET APPLICATION A LA SYNTHÈSE DE L'AGOMELATINE

(57) Abstract : Method for the industrial synthesis of the compound of formula (I).

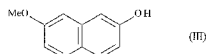
(57) Abrégé : Procédé de synthèse industriel du composé de formule (I)

11
REVENDECTIONS

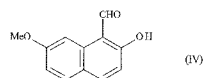
1. Procédé de synthèse industriel du composé de formule (I) :



5 caractérisé en ce que l'on met en réaction le 7-méthoxynaphtalène-2-ol de formule (II) :



sur lequel on introduit sur la position 1 le groupement formyle pour conduire au composé de formule (IV) :



10 composé de formule (IV) qui est soumis à une réaction de sulfonation pour conduire au composé de formule (V) :



WO 2015/082849 A3



Publiée :

- avec rapport de recherche internationale (Art. 21(3))
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues (règle 48.2.h))

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale :

26 novembre 2015

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/FR2014/053159

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
INV.	C07C45/45	C07C45/65
	C07C309/73	C07C233/18
		C07C47/575
		C07C309/65
		C07C309/66
		C07C303/28
ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
C07C		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)		
EPO-Internal, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	GARIGIPATI R S ET AL: "Novel frameworks for trifluoromethyl ketone and phosphonate TSA inhibitors of type II PLA2", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 7, no. 11, 3 June 1997 (1997-06-03), pages 1421-1426, XP004136229, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/S0960-894X(97)00246-1 page 1423, line 10 schéma I, étapes a)-e)	1-22
A	FR 2 918 369 A1 (SERVIER LAB [FR]) 9 January 2009 (2009-01-09) claim 5 page 6	1-22
	----- -/--	
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention	
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone	
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art	
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		
Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report	
6 October 2015	14/10/2015	
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Delanghe, Patrick	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/FR2014/053159

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>KANDAGATLA, B. ET AL: "A facile synthesis of melatonergic antidepressant agomelatine", TETRAHEDRON LETTERS, vol. 53, 26 October 2012 (2012-10-26), pages 7125-7127, XP002727615, cited in the application schéma 2, étapes a)-d) -----</p>	1-22

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/FR2014/053159

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
FR 2918369	A1	09-01-2009	
		AR 070004 A1	10-03-2010
		FR 2918369 A1	09-01-2009
		WO 2009022066 A2	19-02-2009

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale n°

PCT/FR2014/053159

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE INV. C07C45/45 C07C45/65 C07C47/575 C07C309/65 C07C309/66 C07C309/73 C07C233/18 C07C303/28		
ADD. Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB		
B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement) C07C		
Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche		
Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si cela est réalisable, termes de recherche utilisés) EPO-Internal, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS		
Catégorie*	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	GARIGIPATI R S ET AL: "Novel frameworks for trifluoromethyl ketone and phosphonate TSA inhibitors of type II PLA2", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 7, no. 11, 3 juin 1997 (1997-06-03), pages 1421-1426, XP004136229, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/S0960-894X(97)00246-1 page 1423, ligne 10 schéma I, étapes a)-e)	1-22
A	FR 2 918 369 A1 (SERVIER LAB [FR]) 9 janvier 2009 (2009-01-09) revendication 5 page 6	1-22

-/--		
<input checked="" type="checkbox"/> Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents		
<input checked="" type="checkbox"/> Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe		
* Catégories spéciales de documents cités:		
"A" document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent "E" document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date "L" document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée) "O" document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens "P" document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée	"T" document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention "X" document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément "Y" document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier "&" document qui fait partie de la même famille de brevets	
Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée 6 octobre 2015	Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale 14/10/2015	
Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Fonctionnaire autorisé Delanghe, Patrick	

C(suite). DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS		
Catégorie*	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	<p>KANDAGATLA, B. ET AL: "A facile synthesis of melatonergic antidepressant agomelatine", TETRAHEDRON LETTERS, vol. 53, 26 octobre 2012 (2012-10-26), pages 7125-7127, XP002727615, cité dans la demande schéma 2, étapes a)-d) -----</p>	1-22

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Renseignements relatifs aux membres de familles de brevets

Demande internationale n°

PCT/FR2014/053159

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)		Date de publication
FR 2918369	A1	09-01-2009	AR	070004 A1	10-03-2010
			FR	2918369 A1	09-01-2009
			WO	2009022066 A2	19-02-2009
