

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10)

FI/EP2318419 T4

(12)

**MUUTETUSSA MUODOSSA HYVÄKSYTYN EUROOPPAPATENTIN
KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT I ÄNDRAD FORM
TRANSLATION OF AMENDED EUROPEAN PATENT
SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

29.01.2025

(97)

Muutetussa muodossa hyväksytyn Eurooppapatentin
myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska
patentet i ändrad form - Date of grant of amended European
patent

30.10.2024

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

C07F 5/02 (2006 . 01)

C07F 5/04 (2006 . 01)

C07F 5/06 (2006 . 01)

A61K 38/05 (2006 . 01)

A61P 35/00 (2006 . 01)

A61P 29/00 (2006 . 01)

C07K 5/06 (2006 . 01)

C07K 5/078 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP09767050.9

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

16.06.2009

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

30.10.2024

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

16.06.2009 PCT/US2009003602

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

17.06.2008 US 132244 P

31.03.2009 US 211499 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1 • Takeda Pharmaceutical Company Limited , 1-1, Doshomachi 4-chome Chuo-ku , Osaka 540-8645 , (JP)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • ELLIOTT, Eric, L. , 35 N. Crescent Circuit , Brighton MA 02135 , (US)

2 • FERDOUS, Abu, J. , 5 Squire Road , Winchester MA 01890 , (US)

3 • KAUFMAN, Michael, J. , 230 Waltham Street , Lexington MA 02421 , (US)

4 • KOMAR, Sonja, A. , 68 Thomas Street , Belmont MA 02478 , (US)

5 • MAZAIK, Debra, L. , 125 Wilson Street , Holliston MA 01746 , (US)

6 • MCCUBBIN, Quentin, J. , 58 Pinehurst Road , Belmont MA 02478 , (US)

7 • NGUYEN, Phoung, M. , 126 Gore Street 4 , Cambridge MA 02141 , (US)

8 • PALANIAPPAN, Vaithianathan , 7 Spruce Circle , Andover MA 01810 , (US)

9 • SKWIERCZYNSKI, Raymond, D. , 122 Salem Street , Andover MA 01810 , (US)

10 • TRUONG, Nobel, T. , 26 Stallbrook Street , Milford MA 01757 , (US)

11 • VARGA, Csanad, M. , 83 Commonwealth Park W , Newton MA 02459 , (US)

12 • ZAWANEH, Peter, N. , 854 Massachusetts Avenue 12 , Cambridge MA 02139 , (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Papula Oy , P.O.Box 981 , 00101 Helsinki , (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

BORONAATTIESTERIYHDISTEITÄ JA NIIDEN FARMASEUTTISIA KOOSTUMUKSIA

Boronatesterföreningar och farmaceutiska sammansättningar av dem

BORONATE ESTER COMPOUNDS AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS THEREOF

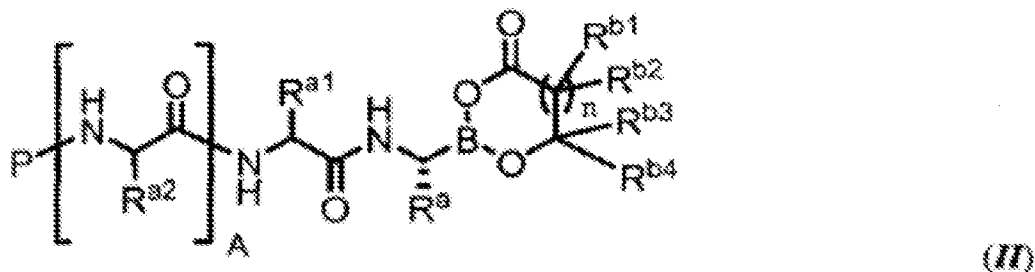
(56)

Viitejulkaisut - Anförda publikationer - References cited

WO-A-02/059130; US-A1- 2002 188 100; US-A1- 2005 282 742;

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste, jolla on kaava (II):



5 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola,
jossa:

A on 0;

R^a on isobutyyli;

R^{a1} on vety;

P on R^c-C(O)-;

10 R^c on -R^D;

-R^D on 2,5-dikloorifenyyli;

15 kumpikin R^{b1}:stä ja R^{b2}:sta on riippumattomasti
vety, -CO₂H, -OH tai substituoitu tai substituoimaton
alifaattinen, aryyli-, heteroaryyli- tai
heterosyklyyliryhmä;

20 kumpikin R^{b3}:sta ja R^{b4}:stä on riippumattomasti
vety, -CO₂H, tai substituoitu tai substituoimaton
alifaattinen, aryyli-, heteroaryyli- tai
heterosyklyyliryhmä;

25 tai R^{b2} ja R^{b4} ovat kumpikin riippumattomasti
vety, ja R^{b1} ja R^{b3}, käsitettynä yhdessä hiiliatomien
kanssa, johon ne ovat liittyneet, muodostavat
substituoimattoman tai substituoituneen fuusioituneen 4-
8-jäsenisen ei-aromaattisen renkaan, jossa on 0-3
30 renkaan heteroatomia valittuna ryhmästä, joka koostuu
O:sta, N:stä ja S:stä, jolloin mainittu rengas voi
valinnaisesti olla fuusioitunut substituoimattomaan
tai substituoituun 4-8-jäseniseen ei-aromaattiseen
renkaaseen tai 5-6-jäseniseen aromaattiseen
renkaaseen, jossa on 0-3 renkaan heteroatomia
valittuna ryhmästä, joka koostuu O:sta, N:stä ja

S:stä;

5 tai R^{b2} ja R^{b4} puuttuvat, ja R^{b1} ja R^{b3} ,
 käsitettynä yhdessä hiiliatomien kanssa, johon ne ovat
 liittyneet, muodostavat substituoimattoman tai
 10 substituoituneen 5-6-jäsenisen aromaattisen
 renkaan, jossa on 0-3 renkaan heteroatomia valittuna
 ryhmästä, joka koostuu O:sta, N:stä ja S:stä, jolloin
 mainittu rengas voi valinnaisesti olla fuusioitunut
 substituoimattomaan tai substituoituun 4-8-jäseniseen
 15 ei-aromaattiseen renkaaseen tai 5-6-jäseniseen
 aromaattiseen renkaaseen, jossa on 0-3 renkaan
 heteroatomia valittuna ryhmästä, joka koostuu O:sta,
 N:stä ja S:stä; ja

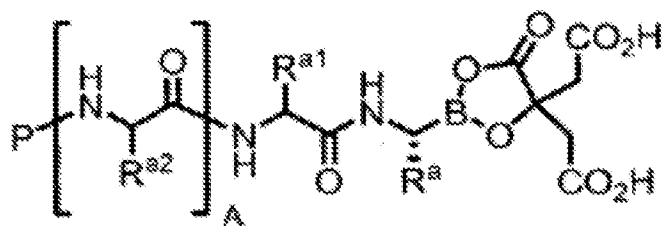
n on 0 tai 1,

15 jossa kumpikin R^{b3} :sta ja R^{b4} :stä on
 riippumattomasti vety, C_{1-6} -alifaattinen, tai $-(CH_2)_p-$
 CO_2H ; ja p on 0, 1 tai 2, ja

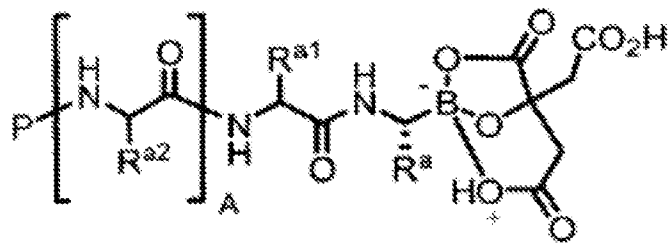
jossa $-OC(O)(CR^{b1}R^{b2})_nCR^{b3}R^{b4}O-$ on
 sitruunahaposta johdettu ryhmä.

20 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen
 yhdiste olennaisesti kiteisessä muodossa.

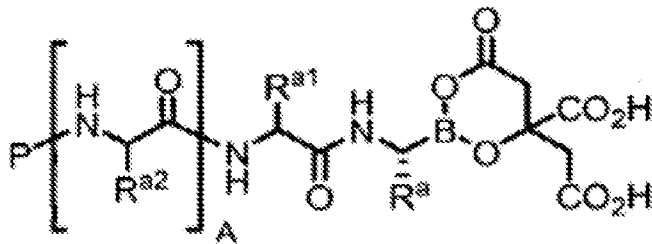
3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen
 yhdiste, tunnettu siitä, että sillä on kaava
 (III), (IIIa), (IV), (IVa):



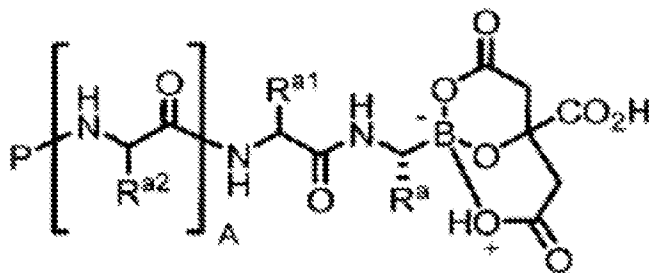
(III);



(IIIa);



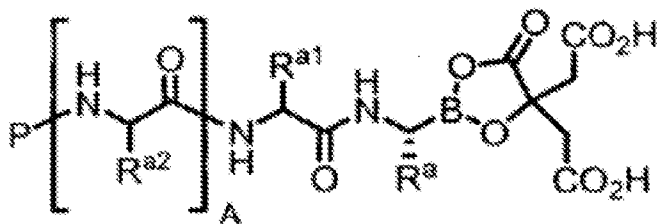
(IV);



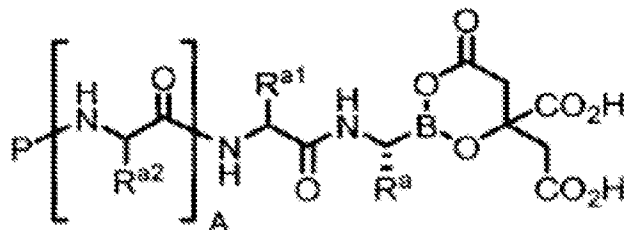
(IVa);

tai niiden seos.

4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, tunnettu siitä, että sillä on kaava
5 (III) tai (IV):



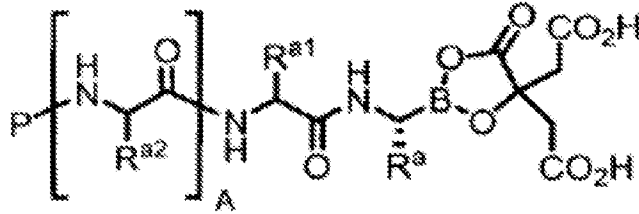
(III);



(IV);

tai niiden seos.

5. Patenttivaatimuksen 4 mukainen yhdiste, tunnettu siitä, että sillä on kaava (III):



(III);

5 6. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää jossakin patenttivaatimuksista 1-5 määritellyn yhdisteen tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan ja jonkin farmaseuttisesti hyväksyttävän kantaja-aineen.