

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

EP/EP3351539 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

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

19.02.2023

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

09.11.2022

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
C07D 309/10 (2006 . 01)
A61P 3/10 (2006 . 01)
A61K 31/351 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP18155079.9

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

(97)

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

25.07.2018

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

26.07.2012 EP EP12177944

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Boehringer Ingelheim Vetmedica GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• ECKHARDT, Matthias, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate patents Binger Straße 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

2• BUTZ, Tanja Maria, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate patents Binger Straße 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

3• HIMMELSBACH, Frank, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate patents Binger Straße 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

4• MARTIN, Hans-Juergen, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate patents Binger Straße 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

LEITZINGER OY, c/o Spaces Mannerheiminaukio 1A, 00100 Helsinki

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**Kiteinen monohydraattikompleksi 1-syaani-2-(4-syklopropylibentsyyli)-4-(β-D-glukopyranos-1-yyli)bentseenistä ja L-proliinista
kidevedessä (1:1:1), menetelmät sen valmistamiseksi ja sen käyttö SGLT-estäjänä**

**Kristallint monohydratkomples av 1-cyano-2-(4-cyklopropylbensyl)-4-(beta-D-glukopyranos-1-yl)-bensen och L-prolin i kristallvatten
(1:1:1), förfaranden för framställning därav samt användande därav som SGLT-inhibitor**

**CRYSTALLINE MONOHYDRATE COMPLEX OF 1-CYANO-2-(4-CYCLOPROPYL-BENZYL)-4-(BETA-D-GLUCOPYRANOS-1-YL)-BENZENE AND L-
PROLINE IN CRYSTAL WATER (1:1:1), METHODS FOR ITS PREPARATION AND ITS USE AS AN SGLT INHIBITOR**

Patenttivaatimukset

1. 1-Syaani-2-(4-syklopropyylibentsyyli)-4-(β -D-glukopyranos-1-yyli)bentseenin ja yhden tai useamman luonnollisen aminohapon välinen kompleksi, **tunnettu siitä,**
 5 **että** luonnollinen aminohappo on L-proliini ja **tunnettu siitä, että** kiteinen kompleksi on 1-syaani-2-(4-syklopropyylibentsyyli)-4-(β -D-gluko-pyranos-1-yyli)bentseenin ja L-proliinin välinen kompleksi (1:1) ja **tunnettu siitä, että** kiteinen kompleksi on kiteinen hydraatti ja **tunnettu siitä, että** 1-syaani-2-(4-syklopropyyli-bentsyyli)-4-(β -D-glukopyranos-1-yyli)bentseenin ja L-proliinin kiteisen
 10 kompleksin moolisuhde kidevetteen on 1:1.
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen kiteinen kompleksi, **tunnettu** röntgenjauhediffraktiokuvioista, joka käsittää piikit kohdissa 20,28, 21,14 ja 21,64 astetta 2Θ ($\pm 0,1$ astetta 2Θ), jolloin mainittu röntgenjauhediffraktiokuva on saatu $\text{CuK}_{\alpha 1}$ -säteilyä
 15 käyttämällä.
3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen kiteinen kompleksi, jossa röntgenjauhediffraktiokuva käsittää lisäksi piikit kohdissa 4,99 ja 23,23 astetta 2Θ ($\pm 0,1$ astetta 2Θ), jolloin mainittu röntgenjauhediffraktiokuva on saatu $\text{CuK}_{\alpha 1}$ -säteilyä käyttämäl-
 20 lä.
4. Jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukainen kiteinen kompleksi, jossa röntgenjauhediffraktiokuva käsittää lisäksi piikit kohdissa 17,61, 17,77 ja 27,66 astetta 2Θ ($\pm 0,1$ astetta 2Θ), jolloin mainittu röntgenjauhediffraktiokuva on saatu $\text{CuK}_{\alpha 1}$ -
 25 säteilyä käyttämällä.
5. Jonkin patenttivaatimuksen 1–4 mukainen kiteinen kompleksi, jossa röntgenjauhediffraktiokuva käsittää piikit kohdissa 4,99, 15,12, 17,61, 17,77, 18,17, 20,28, 21,14, 21,64, 23,23 ja 27,66 astetta 2Θ ($\pm 0,1$ astetta 2Θ), jolloin mainittu röntgen-
 30 jauhediffraktiokuva on saatu $\text{CuK}_{\alpha 1}$ -säteilyä käyttämällä.
6. Jonkin patenttivaatimuksen 1–5 mukainen kiteinen kompleksi, **tunnettu** röntgenjauhediffraktiokuvioista, joka on saatu $\text{CuK}_{\alpha 1}$ -säteilyä käyttämällä, joka röntgenjauhediffraktiokuva käsittää piikit asteilla 2Θ ($\pm 0,1$ astetta 2Θ) seuraavasti:

2 θ [°]	d-arvo [Å]	Intensiteetti I/I₀ [%]
4,99	17,68	39
7,01	12,61	6
8,25	10,70	11
9,95	8,88	12
13,15	6,73	30
13,33	6,64	10
14,08	6,28	4
15,12	5,85	32
16,40	5,40	12
16,49	5,37	13
17,11	5,18	6
17,61	5,03	32
17,77	4,99	35
18,17	4,88	32
18,32	4,84	28
18,72	4,74	8
19,16	4,63	30
19,96	4,45	26
20,28	4,37	56
20,60	4,31	7
21,14	4,20	84
21,64	4,10	100
22,33	3,98	15
23,23	3,83	41
24,06	3,70	4
24,51	3,63	15
24,93	3,57	26
25,89	3,44	23
26,21	3,40	11
26,84	3,32	8
27,66	3,22	38

27,96	3,19	9
28,26	3,16	5
28,44	3,14	6
28,75	3,10	6
29,18	3,06	19

5 **7.** Jonkin patenttivaatimuksen 1–6 mukainen kiteinen kompleksi, **tunnettu** röntgenjauhediffraktiokuvioista, joka on saatu CuK_{α1}-säteilyä käyttämällä, joka röntgenjauhediffraktiokuvio käsittää piikit asteilla $2\Theta (\pm 0,1 \text{ astetta } 2\Theta)$, kuten kuviossa 1 on esitetty.

8. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää yhden tai useamman kiteisen kompleksin, joka on yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–7 mukainen.

10 **9.** Yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–7 mukainen kiteinen kompleksi käytettäväksi lääkkeenä.

15 **10.** Yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–7 mukainen kiteinen kompleksi käytettäväksi sellaisten sairauksien tai tilojen hoidossa tai ennaltaehkäisemisessä, joihin voidaan vaikuttaa estämällä natriumriippuvaista glukoosi-kotransportteria SGLT (eng. sodium-dependent glucose cotransporter).

20 **11.** Yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–7 mukainen kiteinen kompleksi käytettäväksi sellaisten sairauksien tai tilojen hoidossa tai ennaltaehkäisemisessä, joihin voidaan vaikuttaa estämällä natriumriippuvaista glukoosi-kotransportteria SGLT2.