



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2457919 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07H 15/04 (2006.01)
A61K 31/738 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.11.04
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.06.05
(86)	European Application Nr.	11188504.2
(86)	European Filing Date	2008.01.18
(87)	The European Application's Publication Date	2012.05.30
(30)	Priority	2007.01.18, US, 885471 P
(84)	Designated Contracting States:	AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR
(62)	Divided application	EP2121713, 2008.01.18
(73)	Proprietor	Genzyme Corporation, 50 Binney Street, Cambridge, MA 02142, USA
(72)	Inventor	Zhu, Yunxiang, 10 Caulfield Road, Wayland, MA Massachusetts 01778, USA Jiang, Canwen, 14 Heather Lane, Southborough, MA Massachusetts 01772, USA Cheng, Seng H., 10 Jennison Circle, Natick, MA 01760, USA Avila, Luis Z., 11 Sleepy Hollow Lane, Arlington, MA Massachusetts 02474, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	OLIGOSACCHARIDES COMPRISING AN AMINOXY GROUP AND CONJUGATES THEREOF
(56)	References Cited:	US-A1- 2005 169 941 LEES A ET AL: "Versatile and efficient synthesis of protein-polysaccharide conjugate vaccines using aminooxy reagents and oxime chemistry", VACCINE, ELSEVIER LTD, GB, vol. 24, no. 6, 6 February 2006 (2006-02-06), pages 716-729, XP025151960, ISSN: 0264-410X, DOI: 10.1016/J.VACCINE.2005.08.096 [retrieved on 2006-02-06] RODRIGUEZ E C ET AL: "Aminooxy-, Hydrazide-, and Thiosemicarbazide-Functionalized Saccharides: Versatile Reagents for Glycoconjugate Synthesis", JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, EASTON.; US, vol. 63, 1 January 1998 (1998-01-01), pages 7134-7135, XP002484548, ISSN: 0022-3263, DOI: 10.1021/JO981351N [retrieved on 1998-10-01]

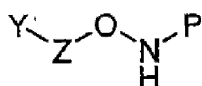
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Fremgangsmåte for å fremstille et oligosakkarid omfattende en aminoksygruppe, der fremgangsmåten er omfattende:

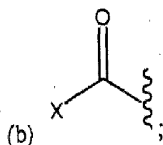
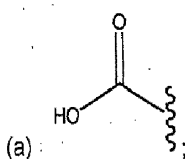
- 5 (a) å tilveiebringe et oligosakkarid omfattende en første reaktiv gruppe hvori den første reaktive gruppen er en hydrazidgruppe eller en karboksylgruppe;
- (b) å tilveiebringe en aminoksyforbindelse omfattende en aminoksygruppe og en andre reaktiv gruppe hvori den andre reaktive gruppen er valgt fra hydrazin-, hydrazid-, semikarbazid-, tiosemikarbazid-, amin-, karboksyl-, ester-, acylhaloid-, acylazid-,
- 10 alkylhaloid-, anhydrid-, isotiocyanat-, isocyanat- og sulfonylhaloidgrupper; og
- (c) å reagere den første reaktive gruppen av oligosakkaridet med den andre reaktive gruppen av aminoksyforbindelsen,
- og derved fremstille oligosakkaridet omfattende en aminoksygruppe.

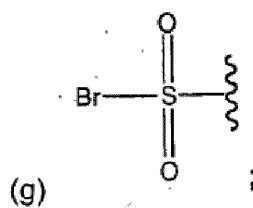
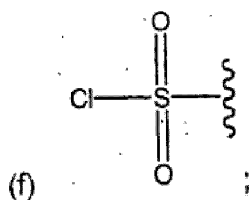
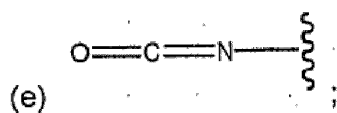
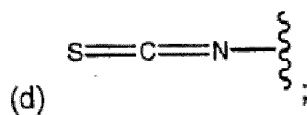
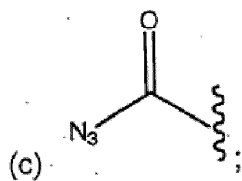
- 15 **2.** Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori aminoksyforbindelsen er valgt fra forbindelser med formel II:

**formel II**

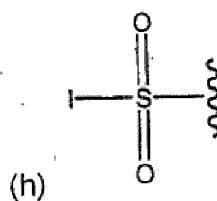
- 20 hvori Y er den andre reaktive gruppen, Z er valgt fra alkyl, alkenyl, alkynyl, heteroaryl, aryl og heterosykl, og P er valgt fra aminobeskyttelsesgrupper.

3. Fremgangsmåten ifølge krav 2, hvori Y er valgt fra:



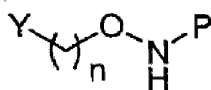


og



hvor X er valgt fra halogener, azid, acyloksy, alkoksy, aryloksy, heteroaryloksy og heterosyklyloksy.

4. Fremgangsmåten ifølge krav 2, hvori aminoalkoxyforbindelsen er valgt fra forbindelser med formel III:

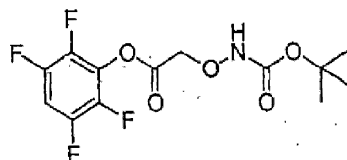


formel III

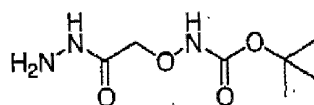
hvor Y er den andre reaktive gruppen, n er valgt fra heltall fra 1 til 10, og P er valgt fra aminobeskyttelsesgrupper.

5

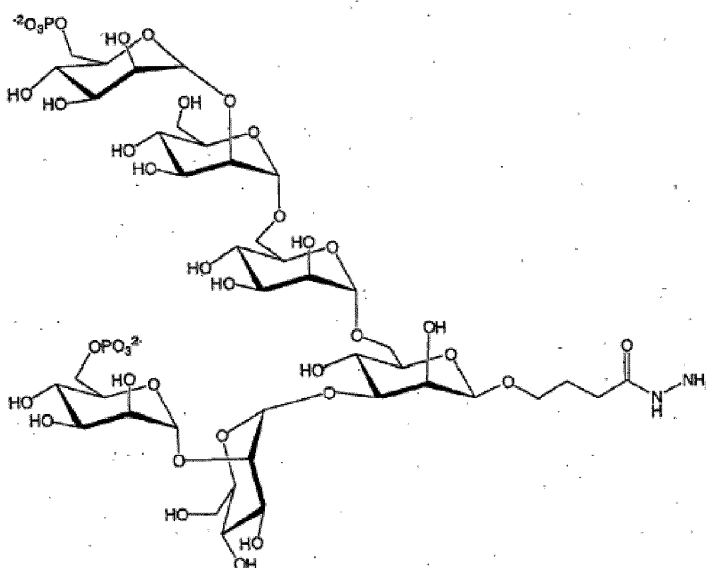
5. Fremgangsmåten ifølge krav 4, hvor aminooksyforbindelsen er



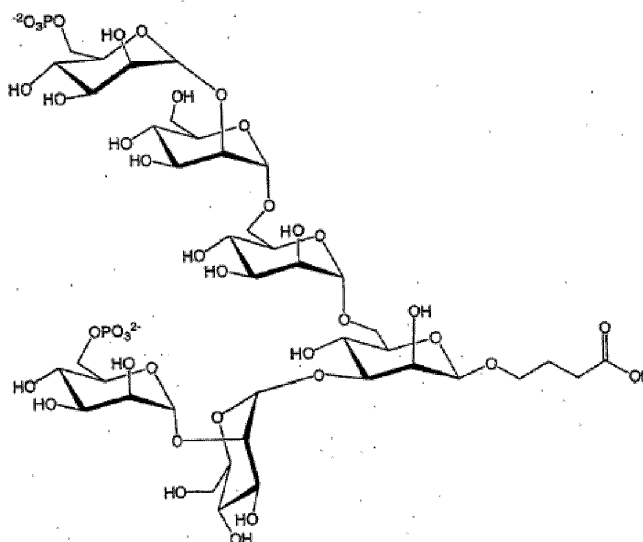
6. Fremgangsmåten ifølge krav 4, hvor aminooksyforbindelsen er



10 **7.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, hvor oligosakkaridet er



eller

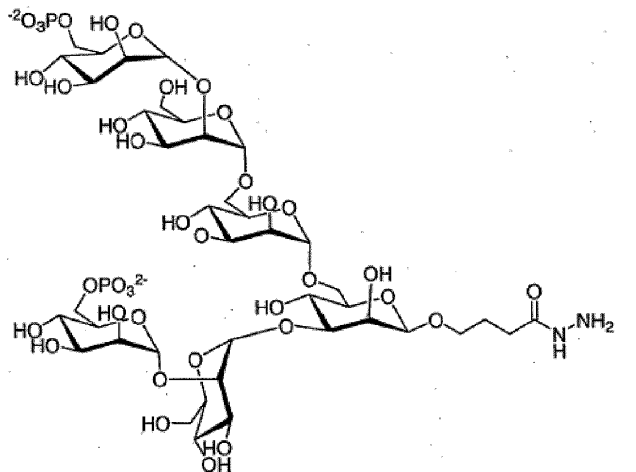


8. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1-7, hvori aminooksyforbindelsen omfatter en aminobeskyttelsesgruppe, hvor fremgangsmåten videre omfatter (d) å avbeskytte oligosakkaridet omfattende en aminoksygruppe.

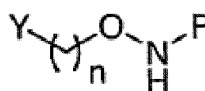
5

9. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvor fremgangsmåten omfatter:

(a) å tilveiebringe et oligosakkarid omfattende en første reaktiv gruppe, hvori oligosakkaridet er



10 (b) å tilveiebringe en aminooksyforbindelse omfattende en aminoksygruppe og en andre reaktiv gruppe, hvori aminooksyforbindelsen er valgt fra forbindelser med formel III:



formel III

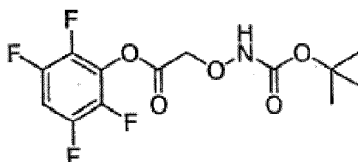
15 hvori n er valgt fra heltall fra 1 til 10, P er valgt fra aminobeskyttelsesgrupper, og Y er

den andre reaktive gruppen; og

(c) å reagere den første reaktive gruppen av oligosakkaridet med den andre reaktive gruppen av aminoksyforbindelsen, og derved fremstille oligosakkaridet omfattende en aminoksygruppe.

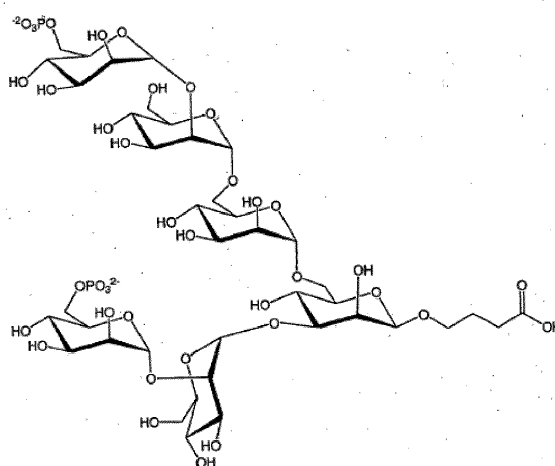
5

10. Fremgangsmåten ifølge krav 9, hvori aminoksyforbindelsen er

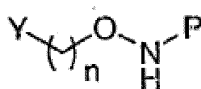


11. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvor fremgangsmåten omfatter:

10 (a) å tilveiebringe et oligosakkarid omfattende en første reaktiv gruppe, hvori oligosakkaridet er



(b) å tilveiebringe en aminoksyforbindelse omfattende en aminoksygruppe og en andre reaktiv gruppe, hvori aminoksyforbindelsen er valgt fra forbindelser med formel III:



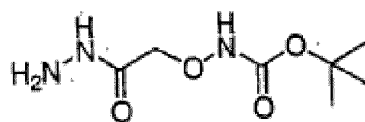
15

formel III

hvor n er valgt fra heltall fra 1 til 10, P er valgt fra aminobeskyttelsesgrupper, og Y er den andre reaktive gruppen; og

20 (c) å reagere den første reaktive gruppen av oligosakkaridet med den andre reaktive gruppen av aminoksyforbindelsen, og derved fremstille oligosakkaridet omfattende en aminoksygruppe.

12. Fremgangsmåten ifølge krav 11, hvori aminoksyforbindelsen er



13. Fremgangsmåten ifølge krav 10 eller 12, hvori trinn (c) omfatter å reagere den første reaktive gruppen av oligosakkaridet med den andre reaktive gruppen av aminoksyforbindelsen i nærvær av en koblingsreagens og/eller en katalysator.