



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3140310 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07F 5/04 (2006.01)
A01N 55/08 (2006.01)
C07F 5/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.11.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.08.07
(86)	European Application Nr.	15788682.1
(86)	European Filing Date	2015.04.30
(87)	The European Application's Publication Date	2017.03.15
(30)	Priority	2014.05.05, US, 201461988690 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Rempex Pharmaceuticals, Inc., 300 TriState International, Suite 272, Lincolnshire, IL, USA
(72)	Inventor	HECKER, Scott, 4802 Rancho Viejo Dr., Del Mar, CA 92014, USA BOYER, Serge, 5112 Castle Hills Drive, San Diego, CA 92109, USA
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

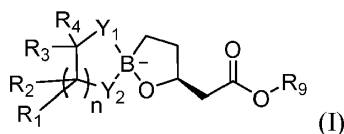
(54) Title **SYNTHESIS OF BORONATE SALTS AND USES THEREOF**

(56) References
Cited: WO-A2-2013/122888
 WO-A1-2012/021455

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. Forbindelse med formel (I)



eller et salt derav, hvori:

n er 0 eller 1;

Y_1 er O eller $N^+R_5R_6$;

Y_2 er O eller NR_{10} ;

R_1 og R_2 velges uavhengig fra gruppen som består av H, eventuelt substituert fenyl og eventuelt substituert C_{1-4} -alkyl, eller R_1 og R_2 sammen med atomene som de er bundet til, danner $=O$;

R_3 velges fra gruppen som består av H, eventuelt substituert fenyl og eventuelt substituert C_{1-4} -alkyl, eller R_3 og R_5 , sammen med atomene som de er bundet til, danner en heteroarylring; eller R_3 og R_4 sammen med atomene som de er bundet til, danner $=O$;

R_4 , R_5 , R_6 og R_{10} velges uavhengig fra gruppen som består av H, eventuelt substituert fenyl og eventuelt substituert C_{1-4} -alkyl; og

R_9 velges fra gruppen som består av eventuelt substituert C_1 - C_{12} -alkyl, eventuelt substituert C_3 - C_8 -syklosykylyl, eventuelt substituert C_2 - C_{12} -alkenyl, eventuelt substituert C_2 - C_{12} -alkynyl, eventuelt substituert aryl, og eventuelt substituert heteroaryl.

2. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori Y_1 er O.

3. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori Y_1 er $N^+R_5R_6$.

4. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori Y_2 er O.

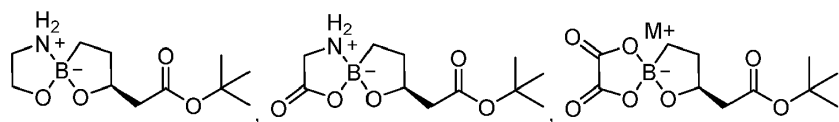
5. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2, hvori Y_2 er NR_{10} .

6. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, hvori R_1 og R_2 begge er H.

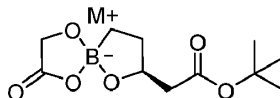
7. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R_1 og R_2 sammen med atomene som de er bundet til, danner $=O$ og hvori R_3 og R_4 sammen med atomene som de er bundet til, danner $=O$.

8. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R_3 og R_4 begge er H.

9. Forbindelsen ifølge krav 1, som har en struktur valgt fra gruppen som består av:



og

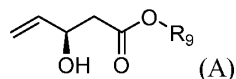


hvor:

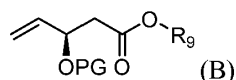
M^+ er et kation valgt fra gruppen som består av litium, natrium, kalium, kalsium, ammonium, trietylammonium og aluminium.

10. Fremgangsmåte for å fremstille en forbindelse med formel (I), eller et salt derav, omfattende trinnene:

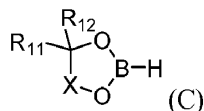
(a) å beskytte hydroksygruppen til en forbindelse med formel (A):



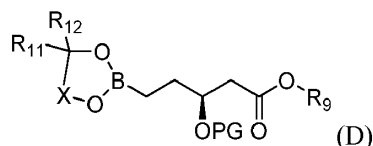
for å danne en forbindelse med formel (B):



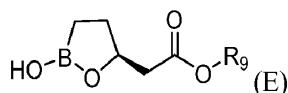
(b) å reagere en forbindelse med formel (B) med en forbindelse med formel (C):



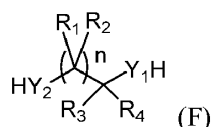
for å danne en forbindelse med formel (D):



(c) å avbeskytte en forbindelse med formel (D) for å danne en forbindelse med formel (E):

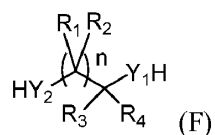


(d) å reagere en forbindelse med formel (E) med et komplekseringsmiddel med formel (F):

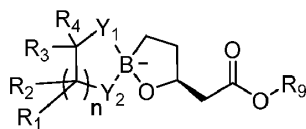


for å danne en forbindelse med formel (I):





for å danne en forbindelse med formel (I):



hvor

n er 0 eller 1,

$$Y_1 \text{ er O eller } N^+R_5R_6$$
$$Y_2 = 0 \text{ eller } NR_{10},$$

R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ og R₁₀ velges uavhengig fra gruppen som består av H, eventuelt substituert fenyl og eventuelt substituert C₁₋₄-alkyl; eller

hvor i uavhengig to geminaler R_1, R_2, R_3, R_4 sammen med atomene som de er bundet til, danner $=O$; og

hvor R₉ er eventuelt substituert C₁-C₁₂-alkyl, eventuelt substituert C₃-C₈-sykloalkyl, eventuelt substituert C₂-C₁₂-alkenyl, eventuelt substituert C₂-C₁₂-alkynyl, eventuelt substituert aryl, eller eventuelt substituert heteroaryl.

13. Fremgangsmåten ifølge krav 12, hvori R₁ og R₂ sammen med atomene som de er bundet til, danner =O og hvori R₃ og R₄ sammen med atomene som de er bundet til, danner =O.