



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3256479 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*C07F 5/02 (2006.01)*  
*A61K 31/69 (2006.01)*  
*A61P 31/06 (2006.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
|------|----------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                | 2020.11.23                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2020.07.29                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (86) | European Application Nr.                                             | 16706002.9                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2016.02.12                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2017.12.20                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (30) | Priority                                                             | 2015.02.12, EP, 15382054<br>2015.02.12, EP, 15382055<br>2015.02.12, EP, 15382056                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (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                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
|      | Designated Extension States:                                         | BA ; ME                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (73) | Proprietor                                                           | GlaxoSmithKline Intellectual Property (No. 2) Limited, 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, Storbritannia<br>Anacor Pharmaceuticals, Inc., 1020 East Meadow Circle, Palo Alto, CA 94303, USA                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (72) | Inventor                                                             | ALEMPARTE-GALLARDO, Carlos, c/o GlaxoSmithKlineParque Tecnologico de Madrid CalleDoctor Severo Ocha, 28760 Tres Cantos (Madrid), Spania<br>ALLEY, M.R.K. (dickon), c/o Anacor Pharmaceuticals Inc.1020 East Meadow Circle, Palo Alto, California 94303, USA<br>BARROS-AGUIRRE, David, c/o GlaxoSmithKlineParque Tecnologico de MadridCalle Doctor Severo Ocha, 28760 Tres Cantos (Madrid), Spania<br>GIORDANO, Ilaria, c/o GlaxoSmithKlineParque Tecnologico de MadridCalle Doctor Severo Ocha, 28760 Tres Cantos (Madrid), Spania<br>HERNANDEZ, Vincent, c/o Anacor Pharmaceuticals Inc.1020 East Meadow Circle, Palo Alto, California 94303, USA<br>LI, Xianfeng, c/o Anacor Pharmaceuticals Inc.1020 East Meadow Circle, Palo Alto, California 94303, USA<br>PLATTNER, Jacob J., c/o Anacor Pharmaceuticals Inc.1020 East Meadow Circle, Palo Alto, California 94303, USA |
| (74) | Agent or Attorney                                                    | ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |

---

(54) Title                      **4 -SUBSTITUTED BENZOXABOROLE COMPOUNDS AND USES THEREOF**

## (56) References

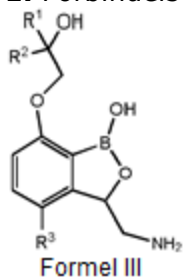
Cited:

WO-A1-2011/127143  
US-A1- 2013 165 411  
WO-A2-2015/021396  
WO-A2-2012/033858

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/>

[EP3256479]

1

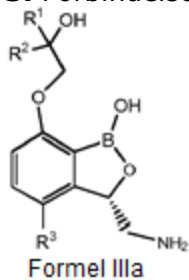
**Patentkrav****1.** Forbindelse med en struktur som vist i formel III:

5 hvori

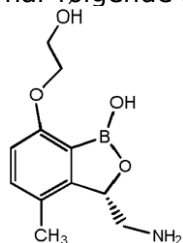
 $R^3$  er  $-\text{CH}_3$ ; og $R^1$  og  $R^2$  er hver uafhængig H eller  $-\text{CH}_3$ ,

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10 **2.** Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori  $R^3$  er  $-\text{CH}_3$ , og hvori  $R^1$  er H, og  $R^2$  er H.

**3.** Forbindelse ifølge krav 1, med en struktur som vist i formel IIIa:15 hvori  $R^3$  er  $-\text{CH}_3$ ; og

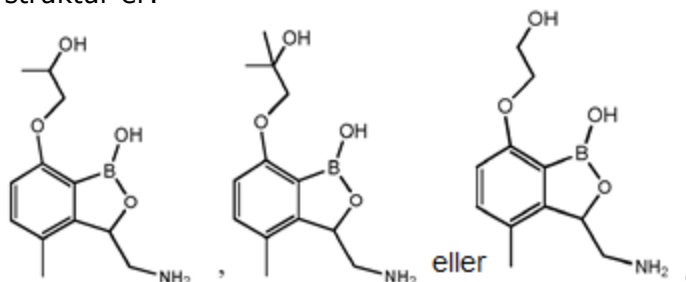
$R^1$  er H, og  $R^2$  er H eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, slik at forbindelsen har følgende struktur:



[EP3256479]

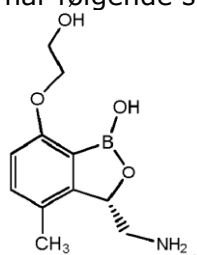
2

**4.** Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvis struktur er:



5

**5.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, som har et NMR-mønster i fast tilstand i det vesentlige som vist i figur 4, hvori forbindelsen har følgende struktur:



10

**6.** Farmasøytisk formulering omfattende:

en forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene; og

en farmasøytisk akseptabel eksipient, adjuvans eller tynner.

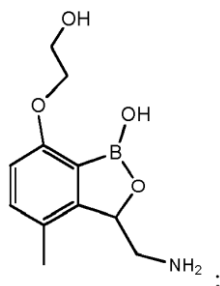
15

**7.** Kombinasjon omfattende:

et første terapeutisk middel eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori det første terapeutiske middelet har strukturen som vist nedenfor:

[EP3256479]

3



og et andre terapeutisk middel.

5 **8.** Kombinasjonen ifølge krav 7, hvori det farmasøytisk akseptable saltet er valgt fra et hydroklorid, et hydrobromid, et hydriodid, et nitrid, et karbon, et monohydrogenkarbonat, et fosfat, et monohydrogenfosfat, et dihydrogenfosfat, et sulfat, et monohydrogensulfat, et dihydrogensulfat eller et fosfonatsalt, foretrukket et hydrokloridsalt eller et dihydrogensulfatsalt.

10 **9.** Kombinasjonen ifølge krav 7 eller krav 8, ytterligere omfattende et eventuelt tredje, fjerde, femte og sjette terapeutisk middel, hvori det andre, tredje, fjerde, femte og sjette terapeutiske middelet er et terapeutisk middel godkjent eller anbefalt for behandling av tuberkulose, foretrukket hvori det andre, tredje, fjerde, femte og sjette terapeutiske middelet er uavhengig valgt fra isoniazid, rifampin,  
15 pyrazinamid, etambutol, moksifloksacin, rifapentin, klofazimin, bedakvilin (TMC207), nitroimidazo-oksazin PA-824, delamanid (OPC-67683), et oksazolidinon foretrukket valgt fra linezolid, tedizolid, radezolid, sutezolid (PNU-100480) eller posizolid (AZD-5847), EMB-analog SQ109, et benzotiazinon, et dinitrobenzamid og et antiviralt middel inkludert et antiretroviralt middel.

20 **10.** Kombinasjon ifølge krav 9, hvori det antiretrovirale middelet er zidovudin, didanosin, lamivudin, zalcitabin, abacavir, stavudin, adefovir, adefovirdipivoksil, fozivudin, todoksil, emtricitabin, alovudin, amdoksovir, elvucitabin, nevirapin, delavirdin, efavirenz, lovirid, immunocal, oltipraz, kapravirin, lersivirin,  
25 GSK2248761, TMC-278, TMC-125, etravirin, saquinavir, ritonavir, indinavir, nelfinavir, amprenavir, fosamprenavir, brecanavir, darunavir, atazanavir, tipranavir, palinavir, lasinavir, enfuvirtid, T-20, T-1249, PRO-542, PRO-140, TNX-355, BMS-806, BMS-663068 og BMS-626529, 5-heliks, raltegravir, elvitegravir,

[EP3256479]

GSK1349572, GSK1265744, vicriviroc (Sch-C), Sch-D, TAK779, maraviroc, TAK449, didanosin, tenofovir, lopinavir eller darunavir, foretrukket hvori det antiretrovirale middelet er GSK1349572 eller GSK1265744.

- 5       **11.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller en farmasøytisk formulering ifølge krav 6 eller en kombinasjon ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 10, for anvendelse i
- 10       behandling av en sykdom som er et resultat av en mykobakteriell infeksjon, hvori den mykobakterielle infeksjonen er en infeksjon fra en mykobakterie valgt
- 15       fra *Mycobacterium tuberculosis*, *Mycobacterium avium* inkludert underarter (subsp.) *Mycobacterium avium subsp. avium*, *Mycobacterium avium subsp. hominissuis*, *Mycobacterium avium subsp. silvaticum* og *Mycobacterium avium subsp. paratuberculosis*; *Mycobacterium kansasii*, *Mycobacterium malmoeense*, *Mycobacterium simiae*, *Mycobacterium szulgai*, *Mycobacterium xenopi*,
- 20       *Mycobacterium scrofulaceum*, *Mycobacterium abscessus*, *Mycobacterium chelonae*, *Mycobacterium haemofilum*, *Mycobacterium leprae*, *Mycobacterium marinum*, *Mycobacterium fortuitum*, *Mycobacterium parafortuitum*, *Mycobacterium gordonae*, *Mycobacterium vaccae*, *Mycobacterium bovis*, *Mycobacterium bovis BCG*, *Mycobacterium africanum*, *Mycobacterium canetti*,
- 25       *Mycobacterium caprae*, *Mycobacterium microti*, *Mycobacterium pinnipedi*, *Mycobacterium leprae*, *Mycobacterium ulcerans*, *Mycobacterium intracellulare*, *Mycobacterium tuberculosis*-kompleks. (MTC), *Mycobacterium avium*-kompleks (MAC), *Mycobacterium avian-intracellulare*-kompleks (MAIC), *Mycobacterium gordonae*-klad; *Mycobacterium kansasii*-klad; *Mycobacterium chelonae*-klad;
- 30       *Mycobacterium fortuitum*-klad; *Mycobacterium parafortuitum*-klad; og *Mycobacterium vaccae*-klad, foretrukket hvori den mykobakterielle infeksjonen er valgt fra *Mycobacterium tuberculosis* eller *Mycobacterium avium*.
- 30       **12.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, farmasøytisk formulering eller kombinasjon for anvendelse ifølge krav 11, hvori den mykobakterielle infeksjonen er en *Mycobacterium tuberculosis*-infeksjon.

[EP3256479]

5

5 **13.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, farmasøytisk formulering eller kombinasjon for anvendelse ifølge krav 11, hvori sykdommen er valgt fra tuberkulose, spedalskhet, Johnes sykdom, Buruli- eller Bairnsdale-ulcus, Crohns sykdom, lungesykdom eller lungeinfeksjon. lungebetennelse, slimpose, synovial, seneskjede, lokal abscess, lymfadenitt, hud- og bløtvevsinfeksjoner Lady Windermers syndrom, MACs lungesykdom, disseminert *Mycobacterium avium*-kompleks (DMAC), disseminert *Mycobacterium avium intracellulare*-kompleks (DMAIC), hot-tub lung, MAC-mastitt, MAC-pyomyositt, *Mycobacterium avium*-paratuberkulose eller granulomsykdom.

10

**14.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, farmasøytisk formulering eller kombinasjon for anvendelse ifølge krav 13, hvori sykdommen er tuberkulose.

15

**15.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, farmasøytisk formulering eller kombinasjon for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 11 til 14, hvori forbindelsen for anvendelse har følgende struktur:

