



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2776038 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*C07D 495/04 (2006.01)*  
*A61K 31/38 (2006.01)*  
*A61K 31/519 (2006.01)*  
*C07D 497/04 (2006.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

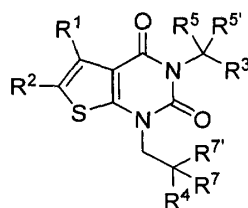
|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
|------|----------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (21) | Translation Published                                                | 2018.06.25                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2018.01.10                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| (86) | European Application Nr.                                             | 12848361.7                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2012.11.09                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2014.09.17                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| (30) | Priority                                                             | 2011.11.11, US, 201161559023 P<br>2012.03.23, US, 201261615092 P<br>2012.05.25, US, 201261651878 P<br>2012.07.25, US, 201261675513 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                                                           | Gilead Apollo, LLC, 333 Lakeside Drive, Foster City CA 94404, US-USA                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
| (72) | Inventor                                                             | HARRIMAN, Geraldine, C., 50 South Arlonda Road, Charlestown, RI 02813, US-USA<br>MASSE, Craig, E., 122 Hamilton Street, Cambridge, MA 02139, US-USA<br>HARWOOD, James, 10 Eska Drive, Ledyard, CT 06339, US-USA<br>BHAT, Sathesh, 55 Riverwalk Place Apt. 943, West New York, NY 07093, US-USA<br>GREENWOOD, Jeremy, Robert, 338 Prospect Place, Brooklyn, NY 11238, US-USA |
| (74) | Agent or Attorney                                                    | TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |

---

(54) Title                    **ACC INHIBITORS AND USES THEREOF**

(56) References  
Cited:                    EP-A1- 0 640 606, EP-A1- 2 351 743, WO-A1-2011/080277, US-A1- 2003 187 254, US-A1- 2005 124 636, JEFFREY W CORBETT: "Review of recent acetyl-CoA carboxylase inhibitor patents: mid-2007 - 2008", EXPERT OPINION ON THERAPEUTIC PATENTS, vol. 19, no. 7, 1 July 2009 (2009-07-01), pages 943-956, XP55009931, ISSN: 1354-3776, DOI: 10.1517/13543770902862180, US-A1- 2007 208 040, US-A1- 2008 287 465, US-B1- 6 180 635, NOBUO CHO ET AL: "Thieno[2, 3-d]pyrimidine-3-acetic Acids A New Class of Nonpeptide Endothelin Receptor Antagonists", CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN, vol. 46, no. 11, 1 November 1998 (1998-11-01), pages 1724-1737, XP55169969, ISSN: 0009-2363, US-A1- 2006 039 943

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 II:****II**

5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

$R^1$  er hydrogen eller  $C_{1-4}$  alifatisk, eventuelt substituert med ett eller flere halogen, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, eller -SO<sub>2</sub>R;

10  $R^2$  er Hy, der Hy er valgt fra 4-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, en 5-6-leddet monosyklisk heteroaromatisk ring som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel eller en 8-10-leddet bisyklisk heteroaromatisk ring som har 1-5 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

15 hver R er uavhengig hydrogen eller en eventuelt substituert gruppe valgt fra  $C_{1-6}$  alifatisk, en 3-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk karbosyklisk ring, fenyl, en 8-10-leddet bisyklisk aromatisk karbosyklisk ring; en 4-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, en 5-6-leddet monosyklisk heteroaromatisk ring som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, eller en 8-10-leddet bisyklisk heteroaromatisk ring som har 1-5 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

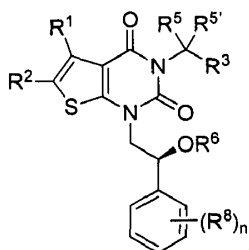
20  $R^3$  er hydrogen, halogen, -CN, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, -SO<sub>2</sub>R, -B(OH)<sub>2</sub>, eller en eventuelt substituert ring valgt fra fenyl eller 5-6-leddet heteroaryl som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

25  $R^4$  er en eventuelt substituert fenyl- eller naftylring;

hver av  $R^5$  og  $R^{5'}$  er uavhengig -R, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, eller -SO<sub>2</sub>R; eller  $R^5$  og  $R^{5'}$  er tatt sammen for å danne en syklopropylenyl-, syklobutylenyl- eller oksetanylgruppe; og

30 hver av  $R^7$  og  $R^{7'}$  er uavhengig hydrogen, -R, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, eller -SO<sub>2</sub>R; eller  $R^7$  og  $R^{7'}$  er tatt sammen for å danne en 3-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk karbosyklisk ring eller en 4-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel.

2. Forbindelse med formel III:



III

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

R<sup>1</sup> er hydrogen eller C<sub>1-4</sub> alifatisk, eventuelt substituert med ett eller flere halogen, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, eller -SO<sub>2</sub>R;

R<sup>2</sup> er Hy, der Hy er valgt fra 4-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, en 5-6-leddet monosyklisk heteroaromatisk ring som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel eller en 8-10-leddet bisyklisk heteroaromatisk ring som har 1-5 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

hver R er uavhengig hydrogen eller en eventuelt substituert gruppe valgt fra C<sub>1-6</sub> alifatisk, en 3-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk karbosyklisk ring, fenyl, en 8-10-leddet bisyklisk aromatisk karbosyklisk ring; en 4-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, en 5-6-leddet monosyklisk heteroaromatisk ring som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, eller en 8-10-leddet bisyklisk heteroaromatisk ring som har 1-5 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

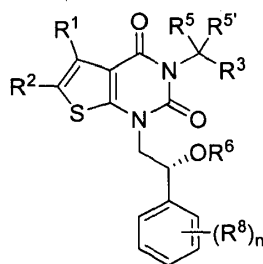
R<sup>3</sup> er hydrogen, halogen, -CN, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, -SO<sub>2</sub>R, -B(OH)<sub>2</sub>, eller en eventuelt substituert ring valgt fra fenyl eller 5-6-leddet heteroaryl som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

hver av R<sup>5</sup> og R<sup>5'</sup> er uavhengig -R, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, eller -SO<sub>2</sub>R; eller R<sup>5</sup> og R<sup>5'</sup> er tatt sammen for å danne en syklopropylenyl-, syklobutylenyl- eller oksetanylgruppe;

R<sup>6</sup> er -R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, eller -C(O)R;

hver R<sup>8</sup> er uavhengig valgt fra halogen, -R, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub> eller deuterium; og n er 0-5.

3. Forbindelse med formel IV:



IV

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

R<sup>1</sup> er hydrogen eller C<sub>1-4</sub> alifatisk, eventuelt substituert med ett eller flere halogen, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, eller -SO<sub>2</sub>R;

R<sup>2</sup> er Hy, der Hy er valgt fra 4-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, en 5-6-leddet monosyklisk heteroaromatisk ring som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel eller en 8-10-leddet bisyklisk heteroaromatisk ring som har 1-5 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

hver R er uavhengig hydrogen eller en eventuelt substituert gruppe valgt fra C<sub>1-6</sub> alifatisk, en 3-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk karbosyklisk ring, fenyl, en 8-10-leddet bisyklisk aromatisk karbosyklisk ring; en 4-8-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, en 5-6-leddet monosyklisk heteroaromatisk ring som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel, eller en 8-10-leddet bisyklisk heteroaromatisk ring som har 1-5 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

R<sup>3</sup> er hydrogen, halogen, -CN, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, -SO<sub>2</sub>R, -B(OH)<sub>2</sub>, eller en eventuelt substituert ring valgt fra fenyl eller 5-6-leddet heteroaryl som har 1-4 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;

hver av R<sup>5</sup> og R<sup>5'</sup> er uavhengig -R, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)C(O)OR, -OC(O)N(R)<sub>2</sub>, -N(R)SO<sub>2</sub>R, -SO<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>, -C(O)R, -C(O)OR, -OC(O)R, -S(O)R, eller -SO<sub>2</sub>R; eller R<sup>5</sup> og R<sup>5'</sup> er tatt sammen for å danne en syklopropylenyl-, syklobutylenyl- eller oksetanylgruppe;

R<sup>6</sup> er -R, -C(O)N(R)<sub>2</sub>, eller -C(O)R;

hver R<sup>8</sup> er uavhengig valgt fra halogen, -R, -OR, -SR, -N(R)<sub>2</sub> eller deuterium; og n er 0-5.

4. Forbindelsen ifølge ett av kravene 1, 2 eller 3, hvori R<sup>1</sup> er metyl eller trifluormetyl.

5. Forbindelsen ifølge ett av kravene 1, 2, 3 eller 4, hvori R<sup>2</sup> er oksazoly.

**6.** Forbindelsen ifølge ett av kravene 1, 2, 3 eller 4, hvori  $R^3$  er tetrazolyl,  $-C(O)OR$ ,  $-C(O)N(R)_2$ , eller  $-OR$ .

**7.** Forbindelsen ifølge ett av kravene 1, 2, 3, 4, 5 eller 6, hvori  $R^5$  og  $R^5$  er hver metyl, eller et  
5 farmasøytisk akseptabelt salt derav.

**8.** Forbindelsen ifølge ett av kravene 1, 2, 3, 4, 5, 6 eller 7, hvori  $R^3$  er  $-C(O)OR$  eller  $-C(O)N(R)_2$ , eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10 **9.** Forbindelsen ifølge ett av kravene 1, 2, 3, 4, 5, 6 eller 7, hvori  $R^3$  er  $-C(O)OH$ , eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

**10.** Sammensetning som omfatter en forbindelse ifølge ett av kravene 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 eller 9, og en farmasøytisk akseptabel bærer, adjuvans eller bærer.