



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3089979 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/18 (2006.01)
A61K 31/4162 (2006.01)
A61P 7/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.03.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.10.18
(86)	European Application Nr.	15747721.7
(86)	European Filing Date	2015.07.29
(87)	The European Application's Publication Date	2016.11.09
(30)	Priority	2014.10.01, US, 201462058316 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	Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, US-USA
(72)	Inventor	DILGER, Andrew K., c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA CORTE, James R., c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA DE LUCCA, Indawati, c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA FANG, Tianan, c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey08534, US-USA YANG, Wu, c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey08534, US-USA WANG, Yufeng, c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA PABBISSETTY, Kumar Balashanmuga, c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey08534, US-USA EWING, William R., c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA ZHU, Yeheng, c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey08534, US-USA WEXLER, Ruth R., c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA PINTO, Donald J.P., c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA ORWAT, Michael J., c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-RockyHill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA

SMITH II, Leon M., c/o Bristol-Myers Squibb Company 311 Pennington-Rocky Hill
Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA

(74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

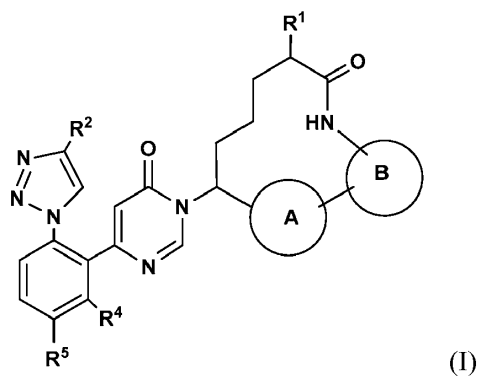
(54) Title **PYRIMIDINONES AS FACTOR XIA INHIBITORS**

(56) References
Cited: WO-A1-2013/093484, WO-A1-2015/116886, WO-A1-2014/022767

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

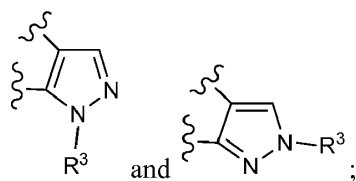
- 5 1. Forbindelse med formel (I):



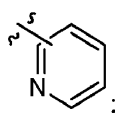
eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:
ring A er uavhengig valgt fra



ring B er uavhengig valgt fra

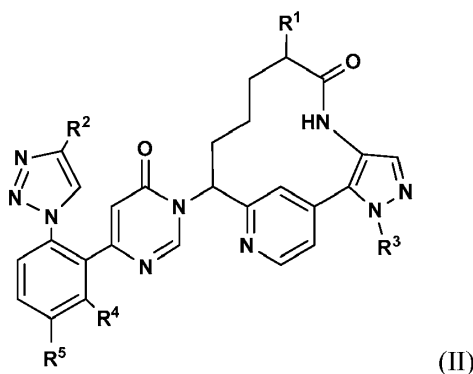


- 15 R^1 er uavhengig valgt fra H og C_{1-4} -alkyl;
 R^2 er uavhengig valgt fra F, Cl, CF_3 , CHF_2 og $COOH$;
 R^3 er uavhengig valgt fra H, CHF_2 , CD_3 , CH_3 , og



- 20 R^4 er uavhengig valgt fra H og F; og
 R^5 er uavhengig valgt fra H, F, Cl, CH_3 og OCH_3 .

2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor R^2 er uafhængig valgt fra F, Cl, CF_3 og CHF_2 .
3. Forbindelse ifølge et hvilket som helst af kravene 1 til 2, med formel (II):



- 5 eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

R^1 er C_{1-4} -alkyl;

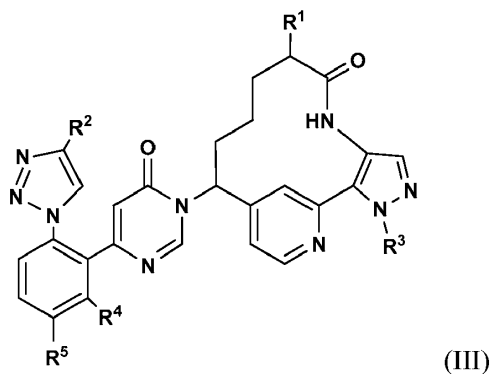
R^2 er uafhængig valgt fra F, Cl, CF_3 og CHF_2 ;

R^3 er uafhængig valgt fra CHF_2 , CD_3 og CH_3 ;

R^4 er H; og

10 R^5 er uafhængig valgt fra F og Cl.

4. Forbindelse ifølge et hvilket som helst af kravene 1 til 3, med formel (III):



eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

15 R^1 er C_{1-4} -alkyl;

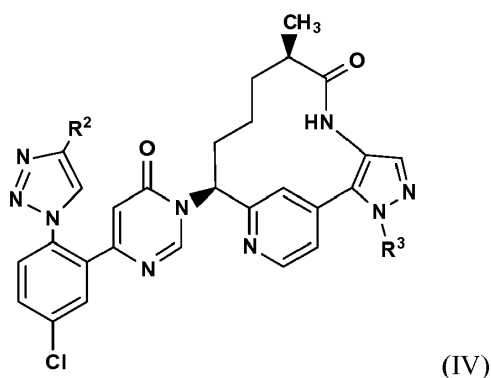
R^2 er uafhængig valgt fra F, Cl, CF_3 og CHF_2 ;

R^3 er uafhængig valgt fra CHF_2 , CD_3 og CH_3 ;

R^4 er H; og

R^5 er uafhængig valgt fra F og Cl.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst af kravene 1 til 4, med formel (IV):

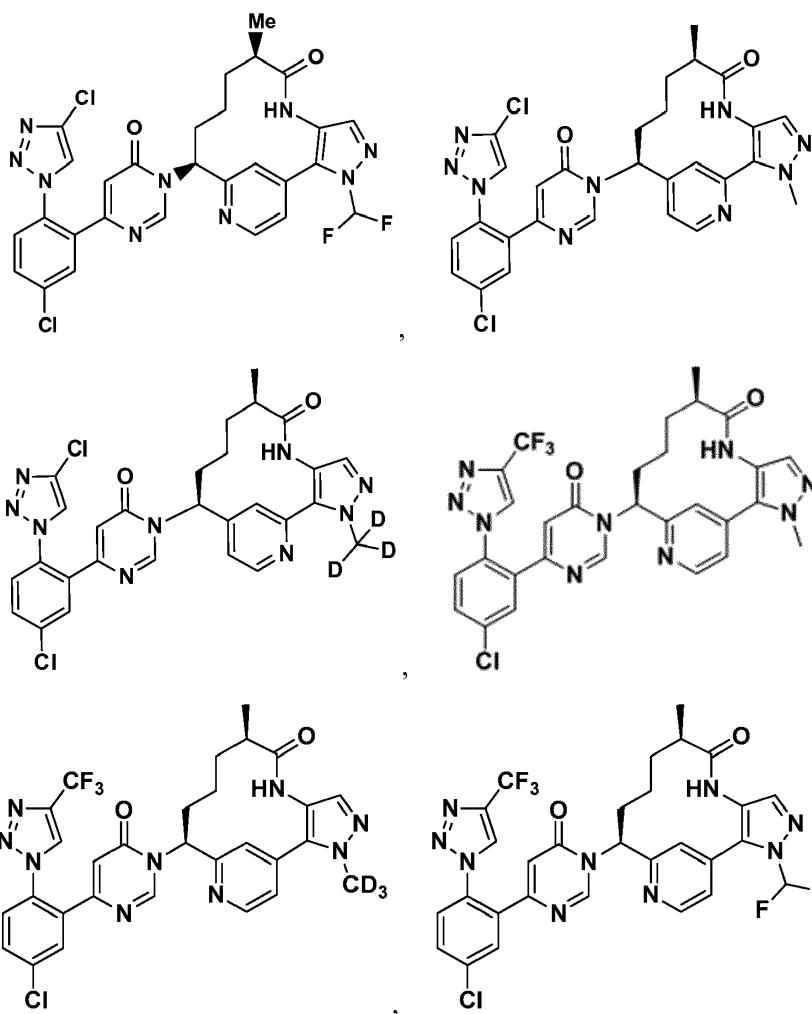


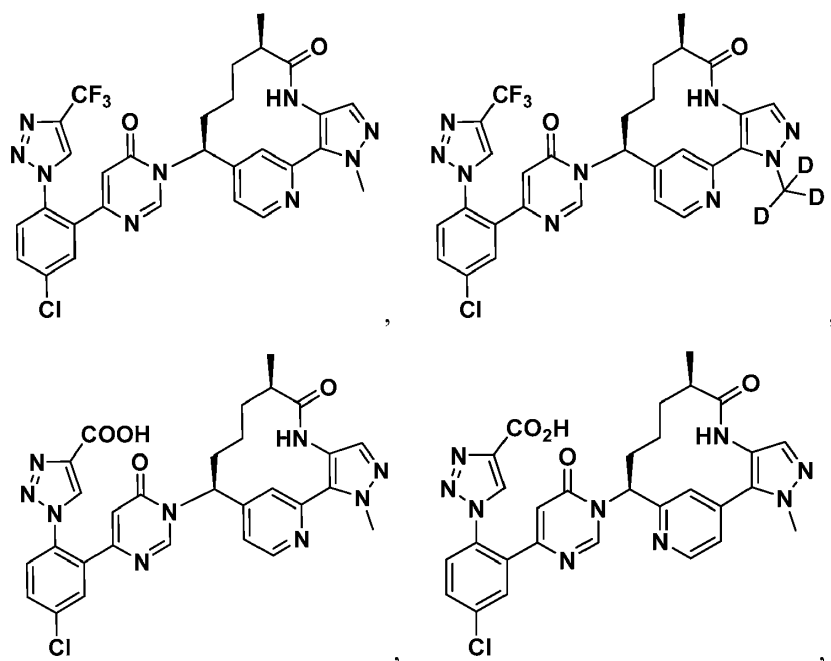
eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

R^2 er uafhængig valgt fra F, Cl, CF_3 og CHF_2 ; og

5 R^3 er uafhængig valgt fra CHF_2 , CD_3 og CH_3 .

6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst af kravene 1 til 5, valgt fra gruppen bestående af:

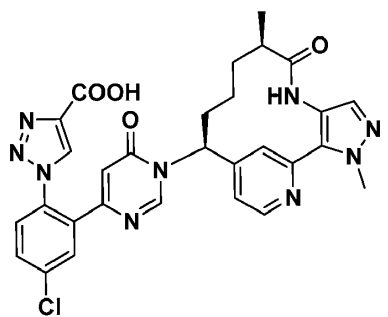




eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5

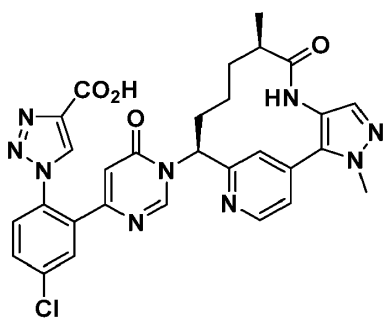
7. Forbindelse ifølge krav 1, med strukturen:



eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

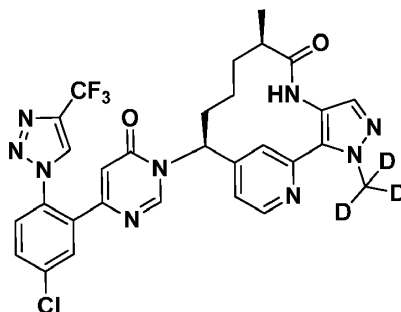
10

8. Forbindelse ifølge krav 1, med strukturen:



eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

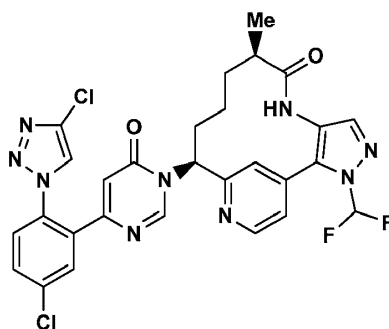
9. Forbindelse ifølge krav 1, med strukturen:



5

eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10. Forbindelse ifølge krav 1, med strukturen:



10

eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

11. Farmasøytisk sammensetning, omfattende én eller flere forbindelser ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10 og en farmasøytisk akseptabel bærer eller tynner.

15

12. Forbindelse eller sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, eller en stereoisomer, en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for bruk som et medikament.

20 13. Forbindelse eller sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, eller en stereoisomer, en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for bruk ved behandling av en tromboembolisk lidelse.

14. Forbindelse, eller stereoisomer, tautomer eller farmasøytisk akseptabelt salt
derav, eller sammensetning for bruk ifølge krav 13, hvor den tromboemboliske
lidelsen er valgt fra arterielle kardiovaskulære tromboemboliske lidelser, venøse
5 kardiovaskulære tromboemboliske lidelser og tromboemboliske lidelser i
hjertekamrene eller i den perifere sirkulasjon.
15. Forbindelse, eller stereoisomer, tautomer eller farmasøytisk akseptabelt salt
derav, eller sammensetning for bruk ifølge krav 14, hvor den tromboemboliske
10 lidelsen er valgt fra ustabil angina, et akutt koronarsyndrom, atriell fibrillasjon,
myokardialt infarkt, forbigående iskemisk anfall, slag, aterosklerose, perifer arteriell
okklusiv sykdom, venøs trombose, dyp venetrombose, tromboflebitt, arteriell
embolisme, koronar arteriell trombose, cerebral arteriell trombose, cerebral
embolisme, nyreembolisme, pulmonær embolisme og trombose som følge av
15 medisinske implantater, anordninger eller inngrep der blod blir eksponert for en
kunstig overflate som fremmer trombose.