



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3157932 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 498/14 (2006.01)
A61K 31/513 (2006.01)
A61K 31/535 (2006.01)
A61K 31/553 (2006.01)
A61K 31/675 (2006.01)
A61P 31/18 (2006.01)
C07D 498/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

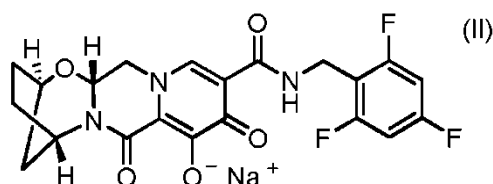
(21)	Translation Published	2018.03.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.01.10
(86)	European Application Nr.	15739063.4
(86)	European Filing Date	2015.06.19
(87)	The European Application's Publication Date	2017.04.26
(30)	Priority	2014.06.20, US, 201462015245 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
	Designated Extension States:	BA; ME
	Designated Validation States:	MA
(73)	Proprietor	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA
(72)	Inventor	CARRA, Ernest, A., c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA CHEN, Irene, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA ZIA, Vahid, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge

(54)	Title	SODIUM (2R, 5S, 13AR) -7, 9-DIOXO-10- ((2,4,6-TRIFLUOROBENZYL) CARBAMOYL) -2, 3, 4, 5, 7, 9, 13, 13A-OCTAHYDRO-2, 5-METHANOPYRIDO [1',2' : 4.5]PYRAZINO [2, 1-B]OXAZEPIN-8-OLATE
(56)	References Cited:	EP-A1- 2 465 580, WO-A1-2014/100323

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:



2. Forbindelse ifølge krav 1, k a r a k t e r i s e r t v e d at den er krystallinsk.

5 3. Forbindelse ifølge krav 2, k a r a k t e r i s e r t v e d et røntgenpulverdiffraksjons (XRPD)-mønster som har topper ved ca. $5,5^\circ$, $16,1^\circ$ og $23,3^\circ$ $2-\theta \pm 0,2^\circ$ $2-\theta$.

4. Forbindelse ifølge krav 3, hvor røntgenpulverdiffraksjons (XRPD)-mønstret har ytterligere topper ved ca. $22,1^\circ$ og $28,5^\circ$ $2-\theta \pm 0,2^\circ$ $2-\theta$.

10 5. Forbindelse ifølge krav 4, hvor røntgenpulverdiffraksjons (XRPD)-mønstret har ytterligere topper ved ca. $22,5^\circ$ og $19,5^\circ$ $2-\theta \pm 0,2^\circ$ $2-\theta$.

6. Forbindelse ifølge krav 5, hvor røntgenpulverdiffraksjons (XRPD)-mønstret har ytterligere topper ved ca. $26,6^\circ$ og $17,9^\circ$ $2-\theta \pm 0,2^\circ$ $2-\theta$.

7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, k a r a k t e r i s e r t v e d at den er delvis eller fullstendig hydrert.

15 8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, k a r a k t e r i s e r t v e d at den er vannfri.

9. Farmasøytisk sammensetning omfattende en terapeutisk virksom mengde av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 og en farmasøytisk akseptabel bærer eller eksipients.

20 10. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, ytterligere omfattende ett til tre ytterligere terapeutiske midler.

11. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 10, hvor hvert av de ytterligere terapeutiske midler er anti-HIV-legemidler.
12. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 10 eller krav 11, hvor hvert av de ytterligere terapeutiske midler er uavhengig valgt fra gruppen bestående av HIV-
5 proteasehemmere, HIV-ikke-nukleosid-hemmere av revers transkriptase, HIV-nukleosid-hemmere av revers transkriptase, HIV-nukleotid-hemmere av revers transkriptase og andre legemidler for behandling av HIV.
13. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 9 til 11, hvor minst to av de ytterligere terapeutiske midler hver er HIV-nukleosid-hemmere av revers
10 transkriptase.
14. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, ytterligere omfattende tenofovirdisoproksilfumarat og emtricitabin.
15. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, ytterligere omfattende tenofoviralafenamid og emtricitabin.
- 15 16. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, ytterligere omfattende tenofoviralafenamidhemifumarat og emtricitabin.
17. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 9 til 15, hvor den farmasøytiske sammensetning er i enhetsdoseringsform.
18. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 17, hvor enhetsdoseringsformen er en
20 tablett.
19. Anvendelse av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 for fremstilling av et legemiddel for behandling eller profylaktisk forebyggelse av en HIV-infeksjon.
20. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 for anvendelse i en
25 fremgangsmåte for behandling eller profylaktisk forebyggelse av en HIV-infeksjon.