



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3277691 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 491/14 (2006.01)
A61K 31/4375 (2006.01)
A61P 31/18 (2006.01)
C07D 491/22 (2006.01)
C07D 498/14 (2006.01)
C07D 498/22 (2006.01)
C07D 513/22 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.06.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.01.30
(86)	European Application Nr.	16716776.6
(86)	European Filing Date	2016.04.01
(87)	The European Application's Publication Date	2018.02.07
(30)	Priority	2015.04.02, US, 201562142338 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 MD
(73)	Proprietor	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(72)	Inventor	CAI, Zhenhong, R., c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA JIN, Haolun, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA LAZERWITH, Scott, E., c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA PYUN, Hyung-Jung, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge

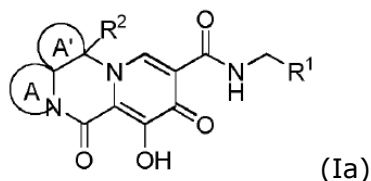
(54)	Title	POLYCYCLIC-CARBAMOYLPYRIDONE COMPOUNDS AND THEIR PHARMACEUTICAL USE
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/099586 BRIAN A. JOHNS ET AL: "Carbamoyl Pyridone HIV-1 Integrase Inhibitors 3. A Diastereomeric

Approach to Chiral Nonracemic Tricyclic Ring Systems and the Discovery of Dolutegravir (S/GSK1349572) and (S/GSK1265744)", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 56, no. 14, 25 July 2013 (2013-07-25) , pages 5901-5916, XP55138762, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm400645w

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 (Ia)



5

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

A er en 4 til 7-leddet monocyklisk heterocyklyl mettet eller delvis umettet og eventuelt substituert med 1 til 5 R^3 grupper;

10 hver R^3 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av C_{1-4} alkyl, halogen og okso; eller to R^3 koblet med samme eller tilstøtende karbonatomer danner en spiro- eller kondensert C_{3-6} cykloalkyl- eller 4 til 6-leddet heterocyklylring;

A' er valgt fra gruppen bestående av C_{3-7} monocyklisk cykloalkyl og 4 til 7-leddet monocyklisk heterocyklyl; hvor hver C_{3-7} monocyklisk cykloalkyl og 4 til 7-leddet monocyklisk heterocyklyl eventuelt er substituert med 1 til 5 R^4 -grupper;

15 hver R^4 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av C_{1-4} alkyl, halogen og okso; eller to R^4 som er koblet til samme eller tilstøtende karbonatomer danner en spiro- eller kondensert C_{3-6} cykloalkyl- eller 4 til 6-leddet heterocyklylring;

R^1 er fenyl eventuelt substituert med 1 til 5 R^5 grupper;

20 hver R^5 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen og C_{1-3} alkyl; og

R^2 er valgt fra gruppen bestående av H, C_{1-3} halogenalkyl og C_{1-4} alkyl.

2. Forbindelse ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor A er en 5- eller 6-leddet monocyklisk heterocyklyl mettet eller delvis umettet og
25 eventuelt substituert med 1 til 5 R^3 grupper;

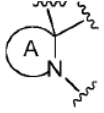
eventuelt hvor A er valgt fra gruppen bestående av oksazolidinyl, piperidinyl, 3,4-umettet piperidinyl, pyrrolidinyl, tetrahydro-1,3-oksazinyl og tiazolidinyl; hver av disse er eventuelt substituert med 1 til 5 R^3 grupper;

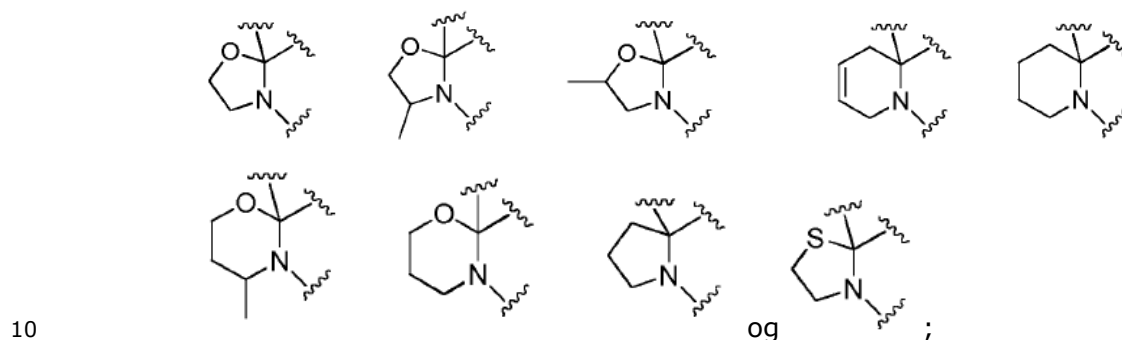
30

eventuelt hvor A er valgt fra gruppen bestående av oksazolidinyl, piperidinyl, 3,4-umettet piperidinyl, pyrrolidinyl, tetrahydro-1,3-oksazinyl og tiazolidinyl; hver av disse er eventuelt substituert med en eller to R^3 -grupper; hvor R^3 er C_{1-4} alkyl; eller to R^3 koblet med samme eller tilstøtende karbonatomer danner en spiro- eller
35 kondensert C_{3-6} cykloalkyl- eller 4 til 6-leddet heterocyklylring;

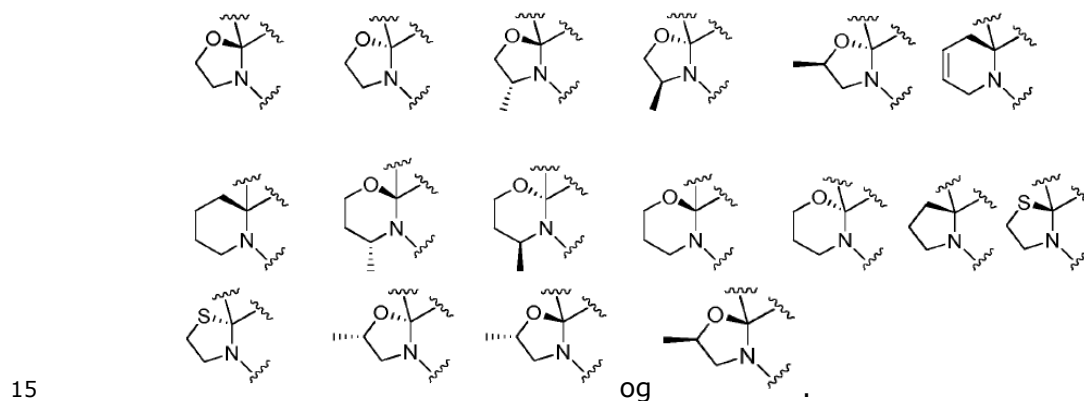
eventuelt hvor A er valgt fra gruppen bestående av oksazolidinyl, piperidinyl, 3,4-umettet piperidinyl, pyrrolidinyl, tetrahydro-1,3-oksazinyll og tiazolidinyl; hver av disse er eventuelt substituert med metyl.

- 5 3. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, eller et

farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor  er valgt fra gruppen bestående av:



eventuelt hvor  er valgt fra gruppen bestående av:



4. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor A' er valgt fra gruppen bestående av C₅-monocyklisk cykloalkyl og 5 til 6-leddet monocyklisk heterocyklyl; hvor hver C₅-monocyklisk cykloalkyl og 5 til 6-leddet monocyklisk heterocyklyl eventuelt er substituert med 1 til 5 R⁴-grupper;
- 20

eventuelt hvor A' er valgt fra gruppen bestående av cyklopentyl, tetrahydrofuranyl, cykloheksyl og tetrahydropyranyl; hver av disse er eventuelt substituert med 1 til 5 R⁴-grupper;

- 5 eventuelt hvor A' er valgt fra gruppen bestående av cyklopentyl, tetrahydrofuranyl, cykloheksyl og tetrahydropyranyl, hvor hver R⁴ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av C₁₋₄alkyl, halogen og okso; eller to R² koblet med samme eller tilstøtende karbonatomer danner en spiro- eller kondensert C₃₋₆cykloalkyl- eller 4 til 6-leddet heterocyklylring;

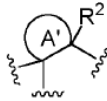
10

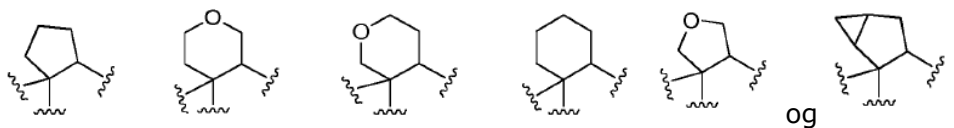
eventuelt hvor A' er valgt fra gruppen bestående av cyklopentyl, tetrahydrofuranyl, cykloheksyl og tetrahydropyranyl; hver av disse er eventuelt fusjonert med en C₃₋₆cykloalkylring;

- 15 eventuelt hvor A' er valgt fra gruppen bestående av cyklopentyl, tetrahydrofuranyl, cykloheksyl og tetrahydropyranyl; hver av disse er eventuelt kondensert med en cyklopropylgruppe.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, eller et
20 farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R² er H.

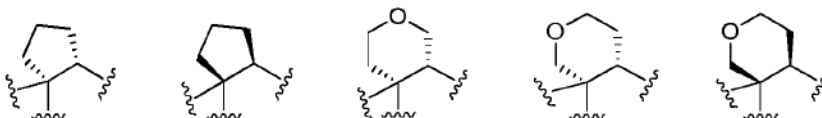
6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, eller et

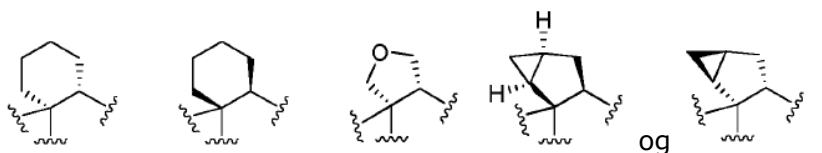
- 25 farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor  er valgt fra gruppen bestående av:



- eventuelt hvor  er valgt fra gruppen bestående av:

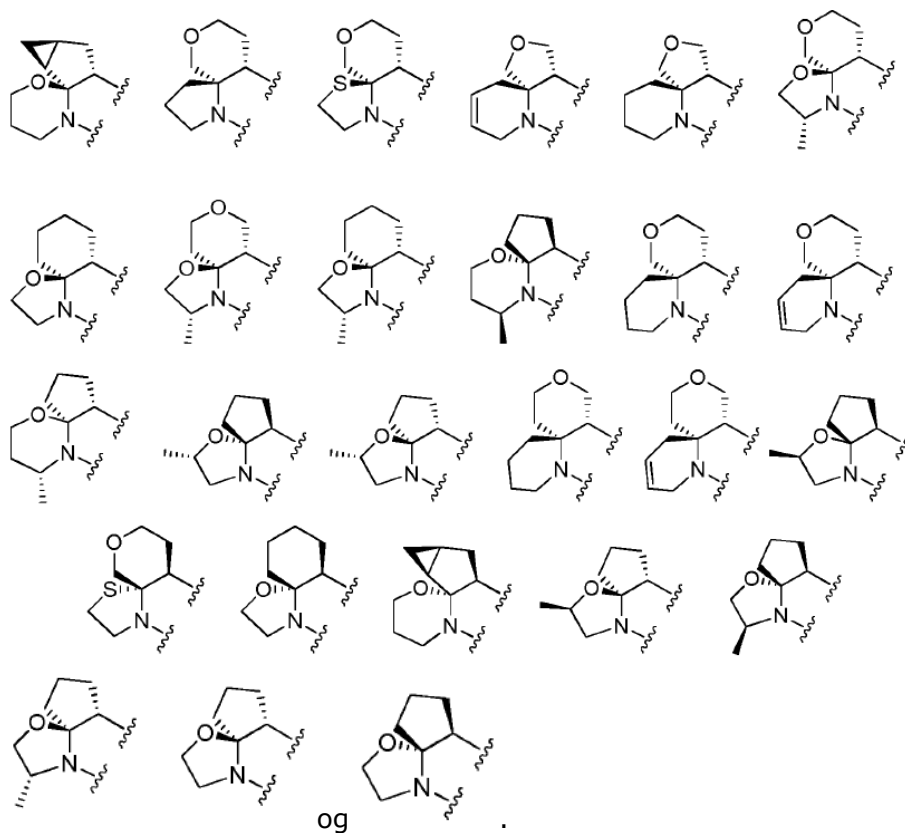
30





7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, eller et

- 5 farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor  er valgt fra gruppen bestående av:



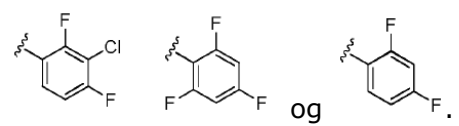
10

8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R^1 er fenyl substituert med to eller tre R^5 grupper, hvor hver R^5 uavhengig er valgt fra gruppen bestående av halogen og C_{1-3} alkyl;

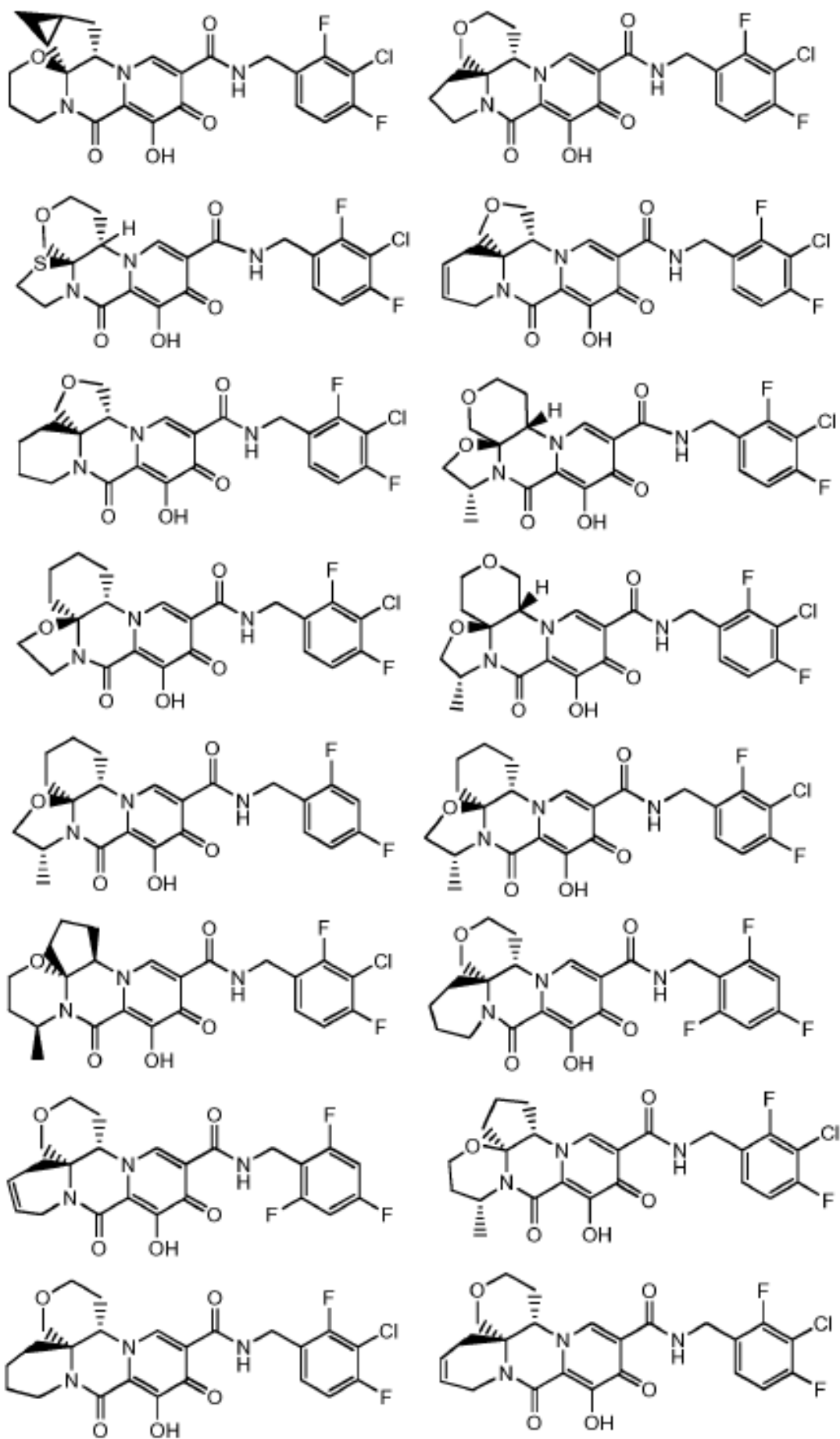
15

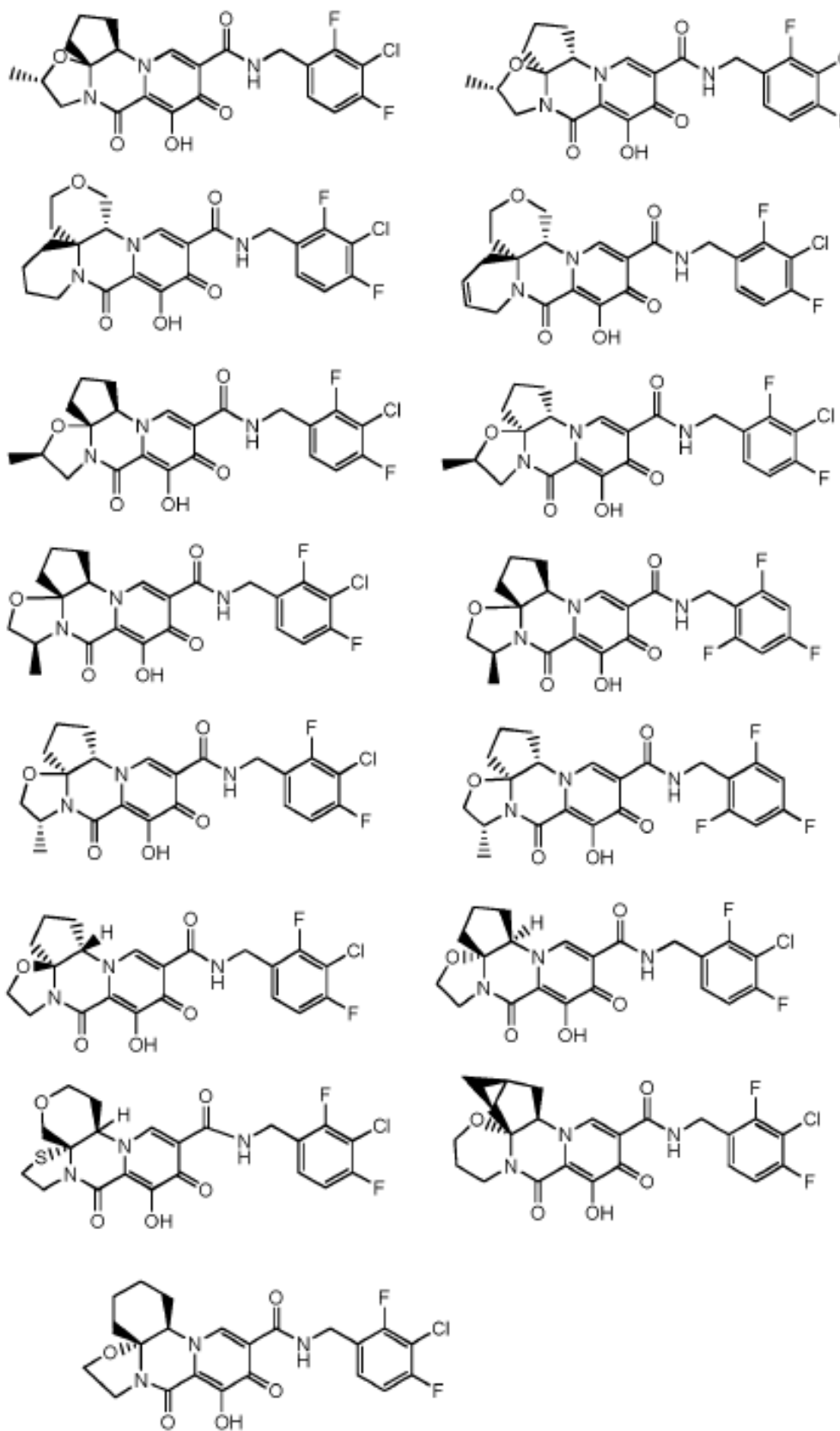
eventuelt hvor R^1 er fenyl substituert med to eller tre R^5 grupper, hvor hver R^5 uavhengig er valgt fra gruppen bestående av fluor og klor;

eventuelt hvor R^1 er valgt fra gruppen bestående av:



9. Forbindelse ifølge krav 1 valgt fra gruppen bestående av:





eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.