



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3413897 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/7076 (2006.01)

A61P 31/18 (2006.01)

A61P 37/02 (2006.01)

C07H 19/173 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.10.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.06.14
(86)	European Application Nr.	17706102.5
(86)	European Filing Date	2017.02.10
(87)	The European Application's Publication Date	2018.12.19
(30)	Priority	2016.02.12, US, 201662294576 P 2016.02.19, US, 201662297657 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	Merck Sharp & Dohme LLC, 126 East Lincoln Avenue, Rahway, New Jersey 07065, USA
(72)	Inventor	HAZUDA, Daria, 770 Sumneytown Pike, West Point Pennsylvania 19486, USA MILLER, Michael D., 351 North Sumneytown Pike, North Wales Pennsylvania 19454, USA GROBLER, Jay A., 770 Sumneytown Pike, West Point Pennsylvania 19486, USA NICOLL-GRIFFITH, Deborah Anne, 261 rue Principale, St-Basile-le-Grand Québec J3N 1H3, Canada
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **METHODS FOR TREATMENT AND PROPHYLAXIS OF HIV AND AIDS**

(56) References

Cited:

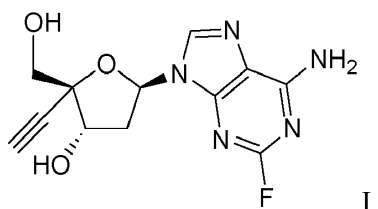
US-B2- 7 339 053

M. MURPHEY-CORB ET AL: "Response of Simian Immunodeficiency Virus to the Novel Nucleoside Reverse Transcriptase Inhibitor 4'-Ethynyl-2-Fluoro-2'-Deoxyadenosine In Vitro and In Vivo", ANTIMICROBIAL AGENTS AND CHEMOTHERAPY, vol. 56, no. 9, 19 June 2012 (2012-06-19), pages 4707-4712, XP055373897, ISSN: 0066-4804, DOI: 10.1128/AAC.00723-12
CHERYL A. STODDART ET AL: "Oral Administration of the Nucleoside EFdA (4'-Ethynyl-2-Fluoro-2'-Deoxyadenosine) Provides Rapid Suppression of HIV Viremia in Humanized Mice and Favorable Pharmacokinetic Properties in Mice and the Rhesus Macaque", ANTIMICROBIAL AGENTS AND CHEMOTHERAPY, vol. 59, no. 7, 1 July 2015 (2015-07-01), pages 4190-4198, XP055373478, ISSN: 0066-4804, DOI: 10.1128/AAC.05036-14

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. En forbindelse med strukturformel I:



5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse i inhiberingen av HIV revers transkriptase, behandlingen av HIV-infeksjon, behandlingen av AIDS eller ARC, forsinkelsen i utbruddet av AIDS eller ARC, eller profylaksen av HIV-infeksjon, AIDS eller ARC i et individ, hvor doseringsregimet er valgt fra én gang i uken, annenhver uke, to ganger i måneden eller én gang i
10 måneden.

2. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1, for inhiberingen av HIV revers transkriptase, behandlingen av HIV-infeksjon, behandlingen av AIDS eller ARC eller forsinkelsen i utbruddet av AIDS eller ARC, hvor forbindelsen eller det
15 farmasøytisk akseptabelt saltet eller ko-krystall derav er administrert oralt.

3. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 2, hvor individet er menneske.

20 **4.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 3, hvor doseringsregimet er én gang i uken.

5. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 4 hvor doseringsmengden er fra 1 mg til 50 mg ved
25 hver administrering.

6. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 4, hvor doseringsmengden er fra 1 mg til 20 mg ved hver administrering.

- 7.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 4, hvor doseringsmengden er 1 mg, 2 mg, 3 mg, 4 mg, 5 mg, 6 mg, 7 mg, 8 mg, 9 mg eller 10 mg ved hver administrering.
- 5
- 8.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 3, hvor doseringsregimet er annenhver uke eller to ganger i måneden.
- 10
- 9.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 8, hvor doseringsmengden er fra 2 mg til 100 mg ved hver administrering.
- 10.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 8, hvor doseringsmengden er fra 2 mg til 40 mg ved hver administrering.
- 15
- 11.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 8, hvor doseringsmengden er 2 mg, 3 mg, 4 mg, 5 mg, 6 mg, 7 mg, 8 mg, 9 mg, 10 mg, 11 mg, 12 mg, 13 mg, 14 mg, 15 mg, 16 mg, 17 mg, 18 mg, 19 mg eller 20 mg ved hver administrering.
- 20
- 12.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 3, hvor doseringsregimet er én gang i måneden.
- 25
- 13.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 12, hvor doseringsmengden er fra 4 mg til 200 mg ved hver administrering.
- 30
- 14.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 12, hvor doseringsmengden er fra 4 mg til 80 mg ved hver administrering.

15. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelsen ifølge krav 12, hvor doseringsmengden er 4 mg, 5 mg, 6 mg, 7 mg, 8 mg, 9 mg, 10 mg, 11 mg, 12 mg, 13 mg, 14 mg, 15 mg, 16 mg, 17 mg, 18 mg, 19 mg eller 20 mg; 21mg, 22 mg, 23 mg, 24 mg, 25 mg, 26 mg, 27 mg, 28 mg, 29 mg eller 30 mg, 31mg, 32 mg, 33 mg, 34 mg, 35 mg, 36 mg, 37 mg, 38 mg, 39 mg eller 40 mg ved hver administrering.

16. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 1, for profylaksen av HIV-infeksjon, AIDS eller ARC, hvor forbindelsen eller det farmasøytisk akseptabelt saltet eller ko-krystallen derav blir administrert oralt.

17. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 16, hvor individet er menneske.

18. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 17, hvor doseringsregimet er én gang i uken.

19. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 18, hvor doseringsmengden er fra 1 mg til 50 mg ved hver administrering.

20. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 18, hvor doseringsmengden er fra 1 mg til 20 mg ved hver administrering.

21. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 18, hvor doseringsmengden er 1 mg, 2 mg, 3 mg, 4 mg, 5 mg, 6 mg, 7 mg, 8 mg, 9 mg eller 10 mg ved hver administrering.

22. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 17, hvor doseringsregimet er annenhver uke eller to ganger i måneden.

23. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 22, hvor doseringsmengden er fra 2 mg til 100 mg ved hver administrering.

5

24. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 22, hvor doseringsmengden er fra 2 mg til 40 mg ved hver administrering.

10 **25.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 22, hvor doseringsmengden er 2 mg, 3 mg, 4 mg, 5 mg, 6 mg, 7 mg, 8 mg, 9 mg, 10 mg, 11 mg, 12 mg, 13 mg, 14 mg, 15 mg, 16 mg, 17 mg, 18 mg, 19 mg eller 20 mg ved hver administrering.

15 **26.** Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 17, hvor doseringsregimet er én gang i måneden.

27. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 26, hvor doseringsmengden er fra 4 mg til 200 mg ved
20 hver administrering.

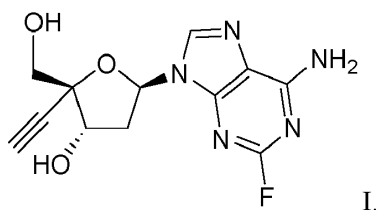
28. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 26, hvor doseringsmengden er fra 4 mg til 80 mg ved
25 hver administrering.

29. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge krav 26, hvor doseringsmengden er 4 mg, 5 mg, 6 mg, 7 mg, 8 mg, 9 mg, 10 mg, 11 mg, 12 mg, 13 mg, 14 mg, 15 mg, 16 mg, 17 mg, 18 mg, 19 mg eller 20 mg; 21mg, 22 mg, 23 mg, 24 mg, 25 mg, 26 mg, 27 mg, 28 mg, 29 mg eller 30 mg, 31mg, 32 mg, 33 mg, 34 mg, 35 mg, 36 mg, 37 mg, 38 mg, 39 mg eller 40 mg ved hver administrering.
30

EP 3 413 897

5

30. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge ett hvilket som helst av krav 1 til 29, hvor forbindelsen er



I.

5

31. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ko-krystall derav, for anvendelse ifølge ett hvilket som helst av krav 1 til 30, hvor HIV-et er HIV-1.