



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3564244 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 498/14 (2006.01)
A61K 31/537 (2006.01)
A61P 31/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.12.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.09.13
(86)	European Application Nr.	19167626.1
(86)	European Filing Date	2015.06.19
(87)	The European Application's Publication Date	2019.11.06
(30)	Priority	2014.06.20, US, 201462015238 P 2014.06.25, US, 201462017183 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 Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(72)	Inventor	CARRA, Ernest A., c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA CHEN, Irene, c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA KEATON, Katie Ann, c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA ZIA, Vahid, c/o Gilead Sciences Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(74)	Agent or Attorney	AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge

(54)	Title	CRYSTALLINE FORMS OF (2R,5S,13AR)-8-HYDROXY-7,9-DIOXO-N-(2,4,6-TRIFLUOROBENZYL)-2,3,4,5,7,9,13,13A-OCTAHYDRO-2,5-METHANOPYRIDO [1',2':4,5]PYRAZINO [2,1-B][1,3]OXAZEPINE-10-CARBOXAMIDE
(56)	References Cited:	WO-A1-2006/116764 WO-A1-2014/100323 CAIRA: "Crystalline Polymorphism of Organic Compounds", TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY, SPRINGER, BERLIN, DE, vol. 198, January 1998 (1998-01), pages 163-208, XP008166276, ISSN: 0340-1022

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. Krystallinsk form for (2R,5S,13aR)-8-hydroksy-7,9-diokso-N-(2,4,6-trifluorbenzyl)-2,3,4,5,7,9,13,13a-oktahydro-2,5-metanopyrido[1',2':4,5]pyrazino-[2,1-b][1,3]oksazepin-10-karboksamid, hvor den krystallinske form er Form III,
5 karakterisert ved et røntgenpulverdiffraksjons (XRPD)-mønster som har topper ved 9,6°, 14,0° og 18,5° 2-θ ± 0,2° 2-θ.
2. Krystallinsk form ifølge krav 1, hvor røntgenpulverdiffraksjons (XRPD)-mønstret har ytterligere topper ved 20,0° og 22,5° 2-θ ± 0,2° 2-θ.
3. Krystallinsk form ifølge krav 1 eller 2, hvor røntgenpulverdiffraksjons
10 (XRPD)-mønstret har ytterligere topper ved 12,1° og 16,2° 2-θ ± 0,2° 2-θ.
4. Krystallinsk form ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor røntgenpulverdiffraksjons (XRPD)-mønstret har ytterligere topper ved 25,0°, 27,0° og 29,0° 2-θ ± 0,2° 2-θ.
5. Farmasøytisk sammensetning omfattende en terapeutisk virksom mengde
15 av formene ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4 og en farmasøytisk akseptabel bærer eller eksipiens.
6. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, ytterligere omfattende ett til tre ytterligere terapeutiske midler.
7. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvor hvert av de ytterligere
20 terapeutiske midler er HIV-motvirkende legemidler.
8. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6 eller krav 7, hvor hvert av de ytterligere terapeutiske midler er uavhengig valgt fra gruppen bestående av HIV-proteasehemmere, HIV-ikke-nukleosid-hemmere av revers transkriptase, HIV-nukleosidhemmere av revers transkriptase, HIV-nukleotidinhitorer av revers
25 transkriptase, og andre legemidler for behandling av HIV.
9. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 6-8, hvor minst to av de ytterligere terapeutiske midler hver er HIV-nukleotid- eller nukleosid-hemmere av revers transkriptase.

10. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, ytterligere omfattende tenofovir-disoproksilfumarat og emtricitabin.
11. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, ytterligere omfattende tenofovir-alafenamid og emtricitabin.
- 5 12. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, ytterligere omfattende tenofovir-alafenamidhemifumarat og emtricitabin.
13. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 12, hvor den farmasøytiske sammensetning er i enhetsdoseringsform, valgfritt hvor enhetsdoseringsformen er en tablett.
- 10 14. Krystallinsk form ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylaktisk forebyggelse av en HIV-infeksjon.