



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3577110 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 405/14 (2006.01)
A61K 31/52 (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01)
A61K 31/553 (2006.01)
A61K 31/685 (2006.01)
A61K 31/688 (2006.01)
A61P 31/18 (2006.01)
C07C 243/28 (2006.01)
C07C 275/16 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 471/08 (2006.01)
C07D 487/08 (2006.01)
C07D 487/10 (2006.01)
C07D 491/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.09.06
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.04.21
(86)	European Application Nr.	18706072.8
(86)	European Filing Date	2018.02.05
(87)	The European Application's Publication Date	2019.12.11
(30)	Priority	2017.02.06, US, 201762455348 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 ; TN
(73)	Proprietor	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(72)	Inventor	BACON, Elizabeth M., c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA

CHIN, Elbert, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA
 COTTELL, Jeromy J., c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA
 KATANA, Ashley Anne, 6599 Nancy Drive, North OlmstedOH 44070, USA
 KATO, Darryl, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA
 LINK, John O., c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA
 SHAPIRO, Nathan, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA
 TREJO MARTIN, Teresa Alejandra, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA
 YANG, Zheng-Yu, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA

(74) Agent or Attorney OSLO PATENTKONTOR AS, Hoffsvæien 1A, 0275 OSLO, Norge

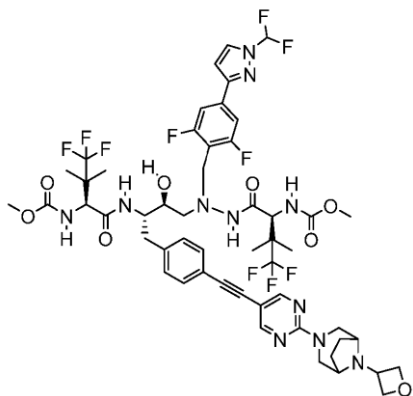
(54) Title **8-OXETAN-3-YL-3,8-DIAZABICYCLO[3.2.1]OCTAN-3-YL SUBSTITUTED COMPOUNDS AS HIV INHIBITORS**

(56) References
 Cited: WO-A2-2008/011117
 CIHLAR T ET AL: "Suppression of HIV-1 Protease Inhibitor Resistance by Phosphonate-mediated Solvent Anchoring", JOURNAL OF MOLECULAR BIOLOGY, ACADEMIC PRESS, UNITED KINGDOM, vol. 363, no. 3, 27 October 2006 (2006-10-27), pages 635-647, XP024951501, ISSN: 0022-2836, DOI: 10.1016/J.JMB.2006.07.073 [retrieved on 2006-10-27]

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/>

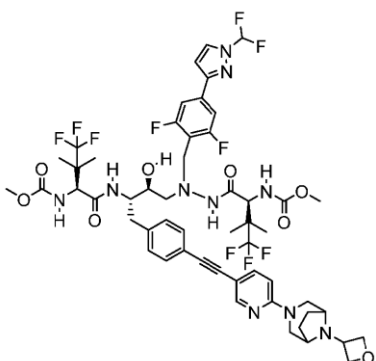
Patentkrav

1. Forbindelse som er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5 2. Forbindelse som er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

3. Farmasøytisk sammensetning omfattende en terapeutisk effektiv mengde av
en forbindelse ifølge krav 1 eller 2 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og
10 en farmasøytisk akseptabel eksipient.

4. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 3, videre omfattende et, to, tre
eller fire ytterligere terapeutiske midler.

15 5. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav
for anvendelse i terapi.

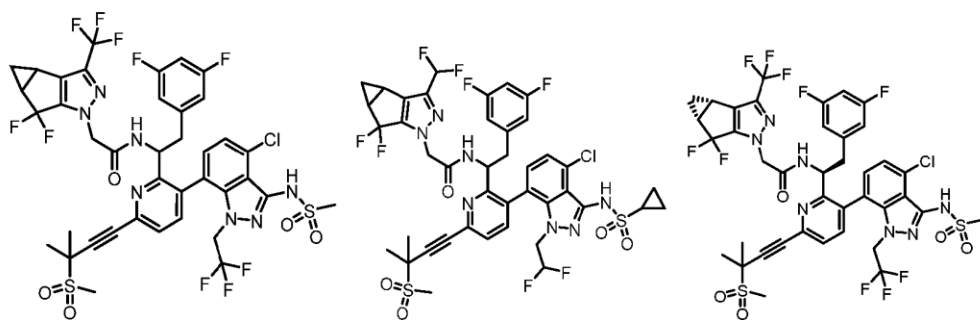
6. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse i en metode for behandling eller forebygging av en human immunsviktvirus (HIV) –infeksjon omfattende å administrere en terapeutisk effektiv mengde av nevnte forbindelse til et individ som har behov for dette.
- 5
7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6, hvor nevnte metode omfatter å administrere et, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler.
8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7, hvor de ytterligere terapeutiske
10 midler administreres samtidig med forbindelsen ifølge krav 1 eller 2 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7, hvor forbindelsen ifølge krav 1 eller 2 er kombinert med de ytterligere terapeutiske midler i en enhetsdoseform for
15 samtidig administrasjon.
10. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7, hvor forbindelsen ifølge krav 1 eller 2 blir administrert og de ytterligere terapeutiske midler blir administrert sekvensielt.
- 20
11. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7 eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, hvor de ytterligere terapeutiske midler er valg fra gruppen besående av kombinasjonsmedikamenter for HIV, andre medikamenter for behandling av HIV, HIV protease inhibitorer, HIV ikke-nukleosid eller ikke-nukleotid inhibitorer for
25 revers transkriptase , HIV nukleosid eller nukleotid inhibitorer for revers transkriptase, HIV integrase inhibitorer, HIV ikke-katalytisk sete (eller allosteriske) integrase-inhibitorer, HIV inngangsinhibitorer, HIV utviklingsinhibitorer, latens-reverserende midler, forbindelser som er rettet mot HIV-kapsidet, immun-baserte behandlinger, fosfatidylinositol 3-kinase (P13K)-inhibitorer, HIV antistoff,
30 bispesifikke antistoff eller «antistoff-liknende» terapeutiske proteiner, HIV p17 matriseprotein-inhibitorer, IL-13 antagonister, peptidyl-prolyl cis-trans isomerase A modulatorer, protein disulfid isomerase-inhibitorer, komplement C5a reseptor-antagonister, DNA metyltransferase-inhibitor, HIV vif genmodulatorer, Vif dimeriseringsantagonister, HIV-1 viral infektivitetsfaktor-inhibitorer, TAT protein-
35 inhibitorer, HIV-1 Nef-modulatorer, Hck kyrosin kinase-modulatorer, blandet linje kinase-3 (MLK-3) inhibitorer, HIV-1 spleising-inhibitorer, Rev proteininhibitorer, integrin-antagonister, nukleoprotein inhibitorer, spleisefaktor-modulatorer, COMM domene-inneholdende protein 1 modulatorer, HIV ribonuklease H-inhibitorer,

retrocyklin-modulatorer, CDK-9 inhibitorer, dendrittisk ICAM-3 hentende nonintegrin 1 inhibitorer, HIV GAG protein inhibitorer, HIV POL protein inhibitorer, Komplement Faktor H modulatorer, ubiquitin ligase-inhibitorer, deoksytydin kinase inhibitorer, cyklin-avhengige kinase-inhibitorer, proprotein konveratse PC9 stimulatorer, ATP-avhengig RNA helikase DDX3X inhibitorer, revers transkriptase aktiveringskompleks inhibitorer, G6PD og NADH-oksidase inhibitorer, farmakokinetiske forsterkere, HIV genterapi og HIV-vaksiner eller en hvilken som helst kombinasjon derav.

12. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7 eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, hvor nevnte forbindelse er kombinert med abacavir-sulfat, bictegravir, tenofovir disproksil, tenofovir disproksil fumarat, tenofovir disproksil hemifumarat, tenofovir alafenamid eller tenofovir alafenamid hemifumarat.

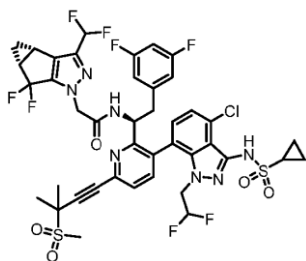
13. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7, hvor nevnte forbindelse er kombinert med et første ytterligere terapeutisk middel valgt fra gruppen bestående av abacavir-sulfat, bictegravir, tenofovir, tenofovir disproksil, tenofovir disproksil fumarat, tenofovir alafenamid og tenofovir alafenamid hemifumarat og et andre ytterligere terapeutisk middel valgt fra gruppen bestående av emtricitabine og lamivudine.

14. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 4 eller 5 eller forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 11, hvor de ytterligere terapeutiske midler er valgt fra gruppen bestående av:



25

og



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 eller 5 eller forbindelse for
anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 11, hvor de ytterligere
5 terapeutiske midler er valgt fra gruppen bestående av abacavirsulfat, bictregravir,
tenofovir, tenofovir disproksil, tenofovir disproksil fumarat, tenofovir disproksil
hemifumarat, tenofovir alafenamid, tenofovir alafenamid hemifumarat,
emtricitabine, lamivudine, GS-9131, dolutegravir og cabotegravir.