



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3938047 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61P 31/18 (2006.01)

C07D 471/04 (2006.01)

A61K 31/4375 (2006.01)

C07D 491/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.10.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.06.22
(86)	European Application Nr.	20719849.0
(86)	European Filing Date	2020.03.20
(87)	The European Application's Publication Date	2022.01.19
(30)	Priority	2019.03.22, US, 201962822703 P 2019.12.16, US, 201962948697 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, California 94404, USA
(72)	Inventor	CHU, Hang, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA GONZALEZ BUENROSTRO, Ana Z., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA GUO, Hongyan, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA HAN, Xiaochun, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA JIANG, Lan, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA LI, Jiayao, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA MITCHELL, Michael L., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA PYUN, Hyung-Jung, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA SCHROEDER, Scott D., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA SCHWARZWALDER, Gregg M., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA SHAPIRO, Nathan D., 2206 Coronet Boulevard, Belmont, California 94002, USA SHIVAKUMAR, Devleena M., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA WU, Qiaoyin, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA YANG, Hong, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA ZHANG, Jennifer R., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA

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

(54) Title **BRIDGED TRICYCLIC CARBAMOYLPYRIDONE COMPOUNDS AND THEIR PHARMACEUTICAL USE**

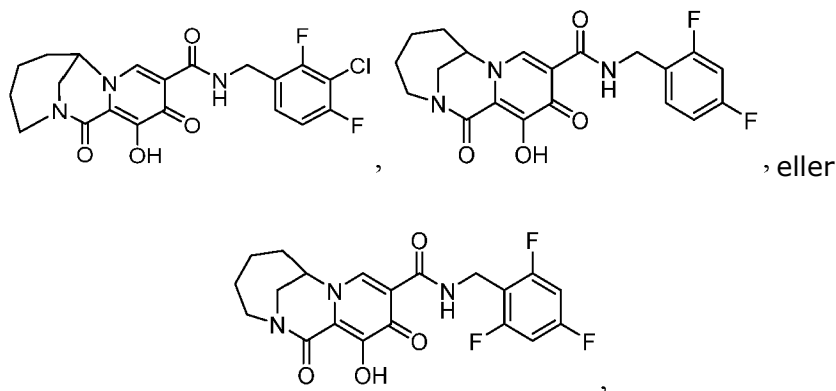
(56) References

Cited: WO-A1-2016/161382
WO-A1-2014/100323
WO-A1-2016/094198
WO-A1-2010/088167
WO-A1-2014/200880

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/>

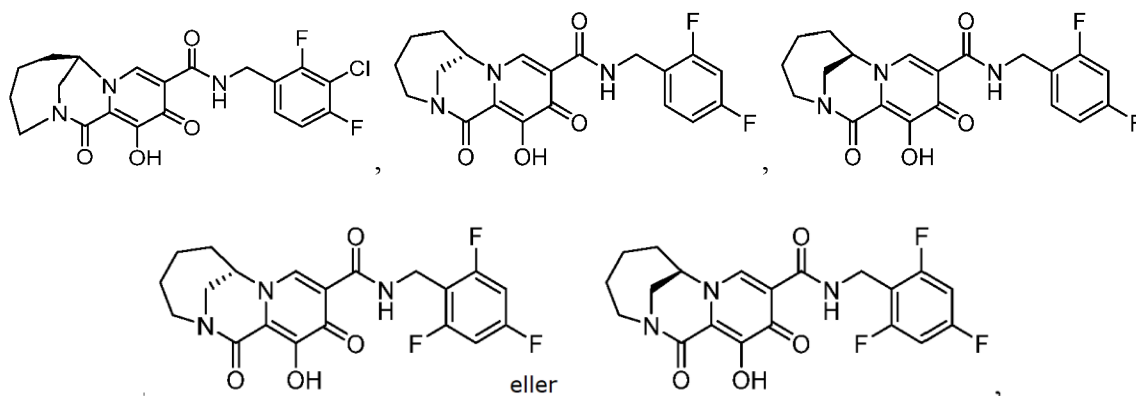
Claims

1. Forbindelse som har formel:



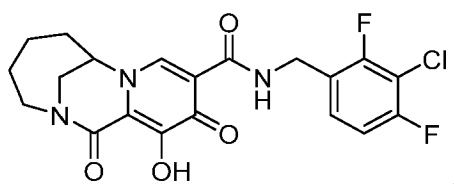
5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

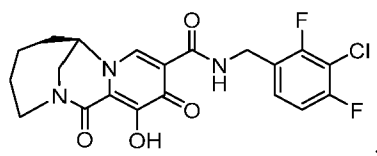
10 3. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

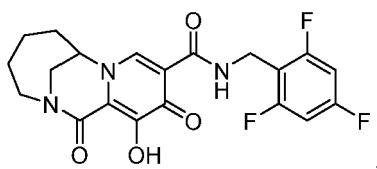
4. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:

2



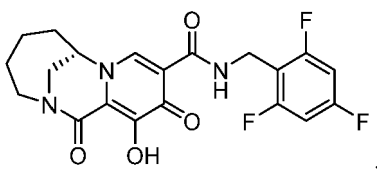
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:



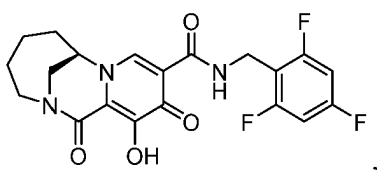
5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

6. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

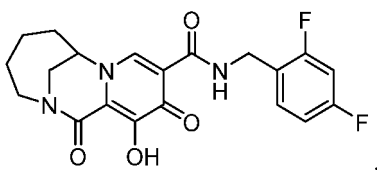
7. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:



10

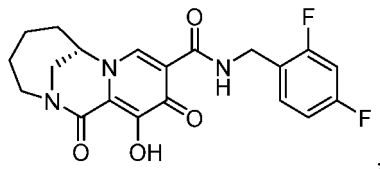
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

8. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:



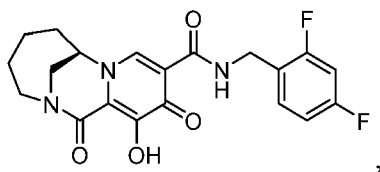
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

9. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5 10. Forbindelse ifølge krav 1, som har formel:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

11. Farmasøytisk sammensetning omfattende en terapeutisk virksom mengde av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10, eller et farmasøytisk
10 akseptabelt salt derav, og en farmasøytisk akseptabel eksipiens.

12. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 11, ytterligere omfattende:

- (i) ett, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler;
- (ii) ett, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler, hvor det eller de ytterligere terapeutiske midler er anti-HIV-midler;
- 15 (iii) ett, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler, hvor det eller de ytterligere terapeutiske midler er HIV-proteasehemmere, HIV-ikke-nukleosid- eller ikke-nukleotid-hemmere av revers transkriptase, HIV-nukleosid- eller nukleotid-hemmere av revers transkriptase, HIV-kapsidhemmere, gp41-hemmere, CXCR4-hemmere, gp120-hemmere,
20 CCR5-hemmere, latensreverserende midler, kapsidpolymerisasjonshemmere, HIV-bNAb'er, TLR7-agonister, farmakokinetiske forsterkere, andre legemidler for behandling av HIV, eller kombinasjoner derav; eller

- (iv) ett, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler, hvor det eller de ytterligere terapeutiske midler er abacavir, tenofovirafenamid, tenofovirdisoproksil, N-((S)-1-(3-(4-klor-3-(metylsulfonamido)-1-(2,2,2-trifluoretyl)-1*H*-indazol-7-yl)-6-(3-metyl-3-(metylsulfonyl)but-1-yn-1-yl)pyridin-2-yl)-2-(3,5-difluorfenyl)etyl)-2-((3*bS*,4*aR*)-5,5-difluor-3-(trifluormetyl)-3*b*,4,4*a*,5-tetrahydro-1*H*-cyklopropa[3,4]cyklopenta-[1,2-*c*]pyrazol-1-yl)acetamid, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

13. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 11 eller 12, hvor den farmasøytiske sammensetning er for oral eller parenteral administrasjon.

14. Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en HIV-infeksjon i et menneske som har eller står i fare for å ha infeksjonen, hvilken fremgangsmåte omfatter å administrere en terapeutisk virksom mengde av forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable salt derav til mennesket.

15. Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 14, ytterligere omfattende å:

- (i) administrere en terapeutisk virksom mengde av ett, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler til mennesket;
- (ii) administrere en terapeutisk virksom mengde av ett, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler til mennesket, hvor det eller de ytterligere terapeutiske midler er anti-HIV-midler;
- (iii) administrere en terapeutisk virksom mengde av ett, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler til mennesket, hvor det eller de ytterligere terapeutiske midler er HIV-proteasehemmere, HIV-ikkenukleosid- eller ikke-nukleotid-hemmere av revers transkriptase, HIV-nukleosid- eller nukleotid-hemmere av revers transkriptase, HIV-kapsidhemmere, gp41-hemmere, CXCR4-hemmere, gp120-hemmere, CCR5-hemmere, latensreverserende midler, kapsidpolymerisasjonshemmere, HIV-bNAb'er, TLR7-agonister, farmakokinetiske forsterkere, andre legemidler for behandling av HIV, eller kombinasjoner derav; eller
- (iv) administrere en terapeutisk virksom mengde av ett, to, tre eller fire ytterligere terapeutiske midler til mennesket, hvor det eller de ytterligere terapeutiske midler er abacavir, tenofovirafenamid,

5 tenofovirdisoproksil, N-((*S*)-1-(3-(4-klor-3-(metylsulfonamido)-1-(2,2,2-trifluoretyl)-1*H*-indazol-7-yl)-6-(3-metyl-3-(metylsulfonyl)but-1-yn-1-yl)pyridin-2-yl)-2-(3,5-difluorfenyl)etyl)-2-((3*bS*,4*aR*)-5,5-difluor-3-(trifluormetyl)-3*b*,4,4*a*,5-tetrahydro-1*H*-cyklopropa[3,4]cyklopenta-[1,2-*c*]pyrazol-1-yl)acetamid, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

16. Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 14 eller 15, hvor administrasjonen er oral, intravenøs, subkutan eller intramuskulær.