



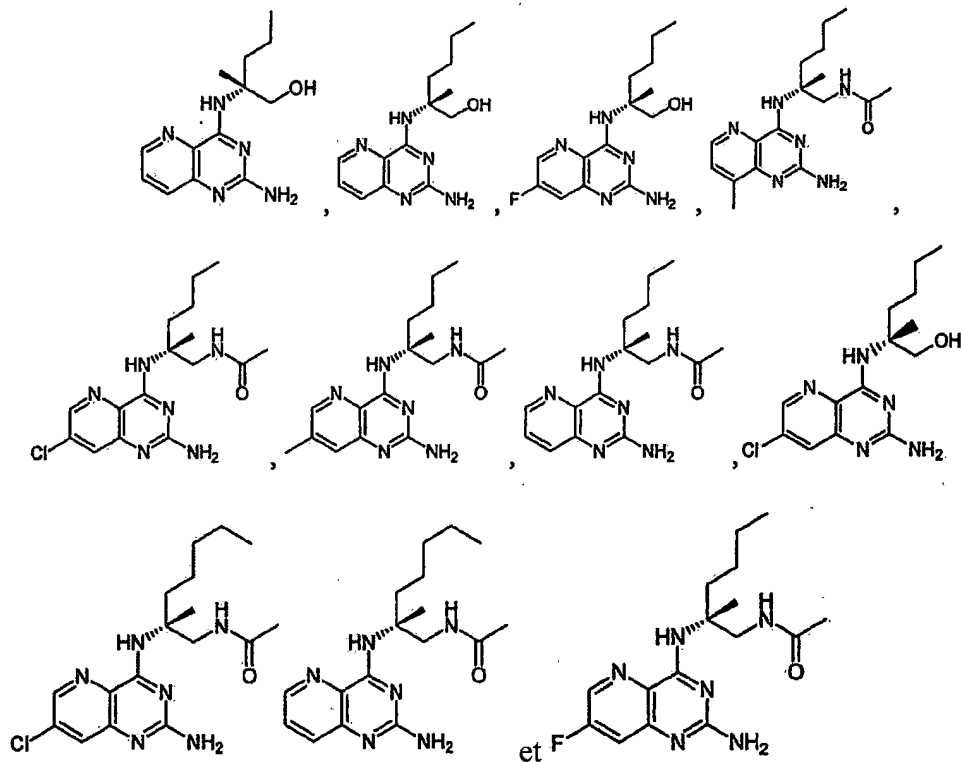
## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 39601 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/519; A61P 29/00; C07D 471/04; A61P 35/00; A61P 37/00; A61P 31/12**
- (43) Date de publication : **31.01.2018**
- 
- (21) N° Dépôt : **39601**
- (22) Date de Dépôt : **01.03.2016**
- (30) Données de Priorité : **03.03.2015 US 201562128397 P**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/US2016/020499 01.03.2016**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation:EP16711723.3
- (71) Demandeur(s) : **Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive Foster City, CA 94404 (US)**
- (72) Inventeur(s) : **PYUN, Hyung-jung ; ZABLOCKI, Jeff ; AKTOUDIANAKIS, Evangelos ; CHIN, Gregory ; MACKMAN, Richard, L. ; METOBO, Samuel, E. ; MISH, Michael, R.**
- (74) Mandataire : **cabinet boutahar & associés**
- 
- (54) Titre : **COMPOSÉS 4,6-DIAMINO-PYRIDO[3,2-D]PYRIMIDINE MODULATEURS DU RÉCEPTEUR DE TYPE TOLL**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne de manière générale des composés modulateurs du récepteur de type Toll, par exemple des composés diamino-pyrido [3,2D] pyrimidine, et des compositions pharmaceutiques qui, entre autres choses, modulent les récepteurs de type Toll (par exemple TLR-8). L'invention porte également sur leurs procédés de fabrication et d'utilisation.

**Revendications****Composés 4,6-diamino-pyrido[3,2-d]pyrimidine modulateurs du récepteur de type toll.**

5

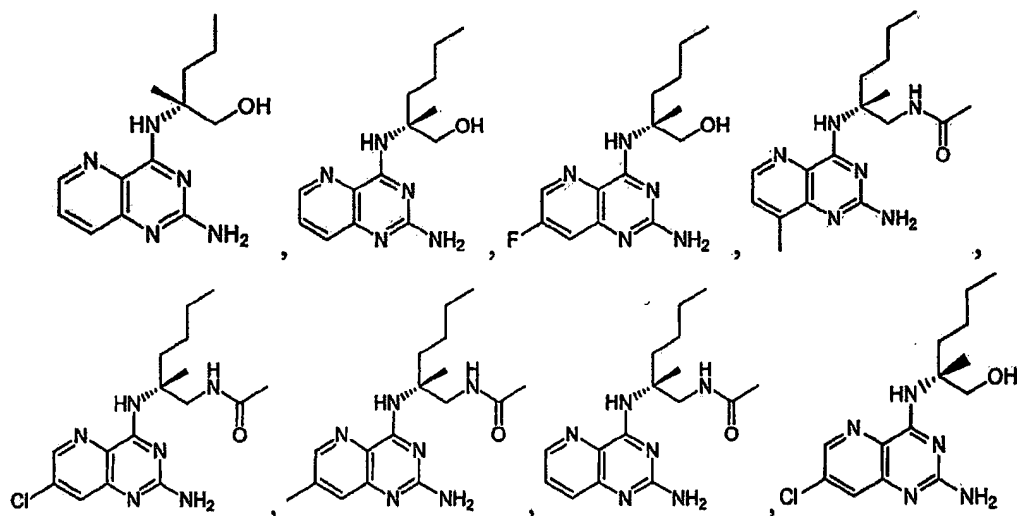
1. Composé choisi parmi:

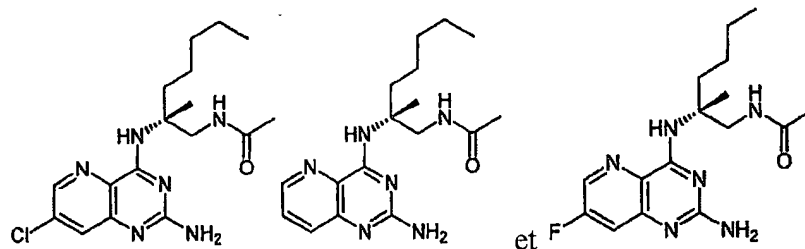


ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

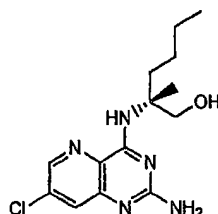
10

2. Composé selon la revendication 1, qui est choisi parmi:



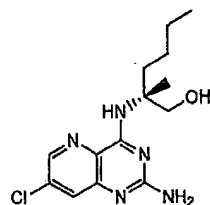


3. Composé selon la revendication 1, qui est:

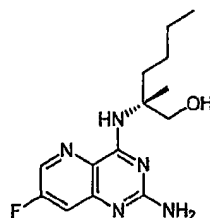


ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

- 5 4. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 3, qui est:

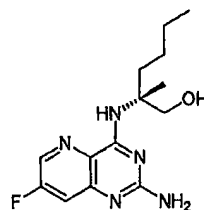


5. Composé selon la revendication 1, qui est:

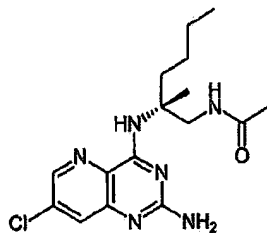


ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

- 10 6. Composé selon l'une quelconque des revendications 1, 2 ou 5, qui est:

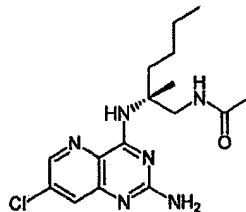


7. Composé selon la revendication 1, qui est:

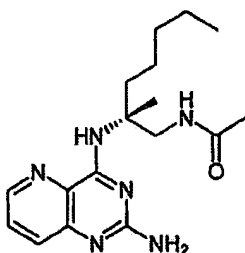


ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

8. Composé selon l'une quelconque des revendications 1, 2 ou 7, qui est:

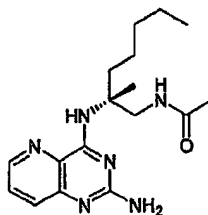


5 9. Composé selon la revendication 1, qui est:



ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

10. Composé selon l'une quelconque des revendications 1, 2 ou 9, qui est:



10 11. Composition pharmaceutique comprenant un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 10, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, et un excipient pharmaceutiquement acceptable.

12. Composé selon l'une quelconque des revendications 1-10, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation dans une thérapie médicale.

13. Composé selon l'une quelconque des revendications 1-10, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation dans le traitement ou la prévention d'une infection par le virus de l'hépatite B.

14. Composé ou sel pour l'utilisation selon la revendication 13, où l'utilisation est en combinaison avec un ou plusieurs agents thérapeutiques supplémentaires.

15. Composé ou sel pour l'utilisation selon la revendication 14, où l'utilisation est en combinaison avec un, deux, trois ou quatre agents thérapeutiques supplémentaires choisis dans le groupe constitué par des inhibiteurs d'ADN polymérase du VHB, des modulateurs de récepteur 7 de type Toll, des modulateurs de récepteur 8 de type Toll, des modulateurs de récepteurs 7 et 8 de type Toll, des modulateurs de récepteur 3 de type Toll, des ligands d'interféron alpha, des inhibiteurs de HbsAg, des composés ciblant HbcAg, des inhibiteurs de cyclophiline, des vaccins thérapeutiques du VHB, des vaccins prophylactiques du VHB, des inhibiteurs d'entrée virale du VHB, des inhibiteurs de NTCP, un oligonucléotide anti-sens ciblant un ARNm viral, des ARNs interférents courts (ARNsi), des inhibiteurs d'antigène E du virus de l'hépatite B, des inhibiteurs de HBx, des inhibiteurs d'ADNccc, des anticorps du VHB incluant des anticorps du VHB ciblant les antigènes de surface du virus de l'hépatite B, des agonistes de thymosine, des cytokines, des inhibiteurs de nucléoprotéine (inhibiteurs de protéine du noyau ou de la capsid du VHB), des stimulateurs de gène inductible par l'acide rétinoïque 1, des stimulateurs de NOD2, des inhibiteurs de réplication de thymosine alpha-1 et du virus de l'hépatite B recombinants, des inhibiteurs de sécrétion ou d'assemblage d'antigène de surface de l'hépatite B (HBsAg), des inhibiteurs deIDO et des combinaisons de ceux-ci.