



(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 39927 B1** (51) Cl. internationale : **A61K 31/4035; A61K 31/437; A61P 7/00; A61K 31/496; A61K 31/495**
- (43) Date de publication : **28.09.2018**

(21) N° Dépôt : **39927**

(22) Date de Dépôt : **27.04.2015**

(30) Données de Priorité : **30.04.2014 EP 14166497**

(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2015/059037 27.04.2015**

(86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation:EP15717916.9

(71) Demandeur(s) : **F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124 4070 Basel (CH)**

(72) Inventeur(s) : **PINARD, Emmanuel ; ALBERATI, Daniela ; KOERNER, Annette ; WINTER, Michael**

(54) Titre : **INHIBITEURS DE GLYT1 POUR LE TRAITEMENT DE TROUBLES HÉMATOLOGIQUES**

(57) Abrégé : L'invention se rapporte à des composés, qui sont des inhibiteurs de GlyT1, destinés à être utilisés dans le traitement de troubles hématologiques, en particulier destinés à être utilisés dans le traitement de la drépanocytose et de la thalassémie, ou dans le traitement de patients atteints de syndromes de surcharge en fer, tels que l'hémochromatose héréditaire.

Revendications

1. Inhibiteur de Glyt1 choisi parmi

la [4-(2-fluoro-4-méthanesulfonyl-phényl)-pipérazin-1-yl]-(2-isopropoxy-5-méthanesulfonyl-
5 phényl)-méthanone

la [5-méthanesulfonyl-2-(2,2,2-trifluoro-1-méthyl-éthoxy)-phényl]-[4-(5-trifluorométhyl-
pyridin-2-yl)-pipérazin-1-yl]-méthanone

le 4-isopropoxy-N-méthyl-3-[4-(4-trifluorométhyl-phényl)-pipérazine-1-carbonyl]-benzène-
sulfonamide

10 la [4-(3-fluoro-5-trifluorométhyl-pyridin-2-yl)-pipérazin-1-yl]-[5-méthanesulfonyl-2-
((S)-2,2,2-trifluoro-1-méthyl-éthoxy)-phényl]-méthanone

la [5-méthanesulfonyl-2-((S)-2,2,2-trifluoro-1-méthyl-éthoxy)-phényl]-(3-trifluorométhyl-5,7-
dihydro-pyrrolo[3,4-b]pyridin-6-yl)-méthanone

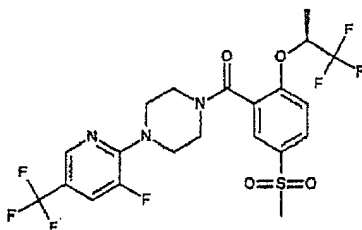
la [5-méthanesulfonyl-2-((S)-2,2,2-trifluoro-1-méthyl-éthoxy)-phényl]-(6-trifluorométhyl-1,3-
15 dihydro-pyrrolo[3,4-c]pyridin-2-yl)-méthanone

ou

la [5-méthanesulfonyl-2-((S)-2,2,2-trifluoro-1-méthyl-éthoxy)-phényl]-(5-méthoxy-6-
trifluorométhyl-1,3-dihydro-isindol-2-yl)-méthanone

destiné à être utilisé pour le traitement ou la prévention de troubles hématologiques choisis
20 parmi la drépanocytose, la thalassémie et le syndrome de la surcharge en fer, en particulier
pour le traitement de l'hémochromatose héréditaire.

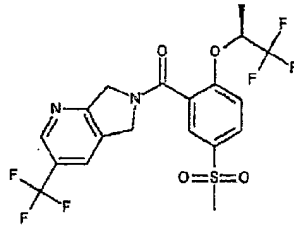
2. Inhibiteur de Glyt1 destiné à être utilisé selon la revendication 1, l'inhibiteur
de Glyt1 étant choisi parmi :



25 la [4-(3-fluoro-5-trifluorométhyl-pyridin-2-yl)-pipérazin-1-yl]-[5-méthanesulfonyl-2-
((S)-2,2,2-trifluoro-1-méthyl-éthoxy)-phényl]-méthanone.

3. Inhibiteur de Glyt1 destiné à être utilisé selon la revendication 1, l'inhibiteur

de Glyt1 étant choisi parmi



la [5-méthanesulfonyl-2-((S)-2,2,2-trifluoro-1-méthyl-éthoxy)-phényl]-(3-trifluorométhyl-5,7-
5 dihydro-pyrrolo[3,4-b]pyridin-6-yl)-méthanone.

4. Inhibiteur de Glyt1 destiné à être utilisé selon l'une quelconque des
revendications 1 à 3, l'inhibiteur de Glyt1 étant sous une forme pharmaceutiquement
acceptable et faisant partie d'une composition pharmaceutique et le trouble étant choisi parmi
la drépanocytose et la thalassémie, le syndrome de la surcharge en fer, en particulier
10 l'hémochromatose héréditaire.