ROYAUME DU MAROC

OFFICE MAROCAIN DE LA PROPRIETE INDUSTRIELLE ET COMMERCIALE
---

(19)

المملكة المغربية

المكتب المغربي
للملكية الصناعية و التجارية
---

(12) BREVET D'INVENTION

(11) N° de publication :
MA 41251 B1

(43) Date de publication :
30.09.2019

(51) Cl. internationale :
A61K 31/506; C07D 513/04; A61P 35/00

---

(21) N° Dépôt :
41251

(22) Date de Dépôt :
16.12.2015

(30) Données de Priorité :
22.12.2014 US 201462095185 P

(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:
PCT/US2015/065940 16.12.2015

(86) N° de dépot auprès de l'organisme de validation:EP15823869.1

(71) Demandeur(s) :
Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center Indianapolis, IN 46285 (US)

(72) Inventeur(s) :
JOSEPH, Sajan ; MCMILLEN, William T. ; ZHAO, Gaiying ; CORTEZ, Guillermo S. ; MCLEAN, Johnathan Alexander ; RODRIGUEZ, Michael John

(74) Mandataire :
H & H CONSULTING LAW FIRM

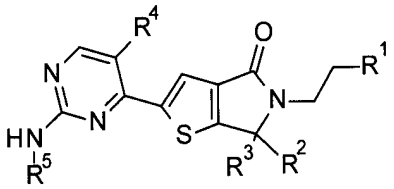
---

(54) Titre : **DÉRIVÉS DE THIÉNO[2,3-C]PYRROL-4-ONE COMME INHIBITEURS ERK**

(57) Abrégé : La présente invention concerne des composés de thiéno[2,3-c]pyrrol-4-one qui inhibent l'activité de la kinase régulée par un signal extracellulaire (ERK) et peuvent être utiles dans le traitement du cancer.

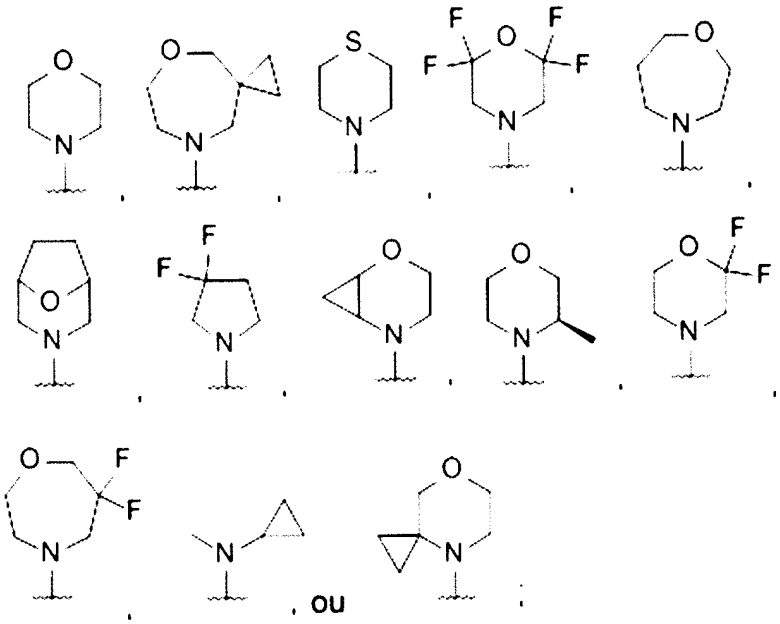
REVENDICATIONS

1. Composé de formule :



dans lequel :

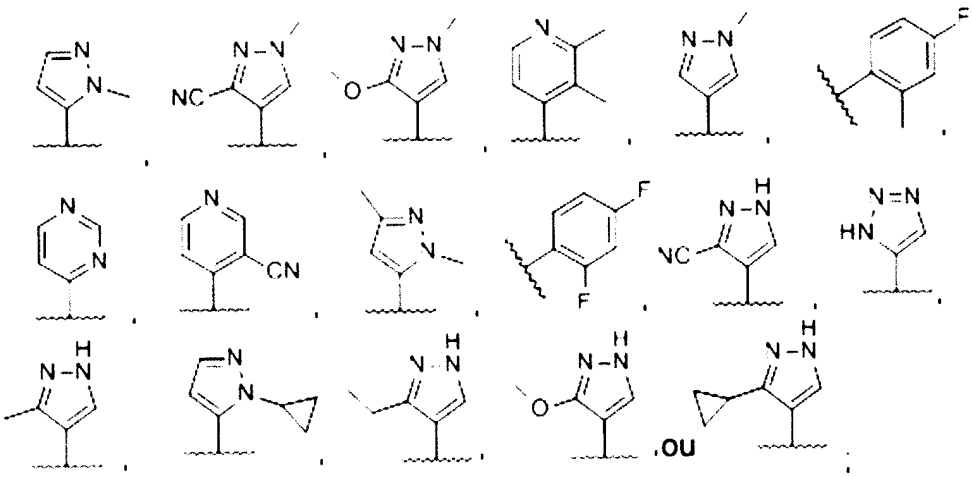
R^1 est



R^2 et R^3 sont un méthyle ou R^2 et R^3 peuvent être pris ensemble afin de former un cyclopropyle ;

R^4 est un hydrogène, un méthyle, un chloro, un fluoro ou un trifluorométhyle ; et

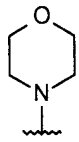
R^5 est

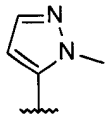


ou son sel pharmaceutiquement acceptable.

2. Composé ou sel selon la revendication 1 dans lequel R^2 et R^3 sont indépendamment un méthyle.

3. Composé ou sel selon la revendication 2 dans lequel R^4 est un hydrogène.

4. Composé ou sel selon la revendication 3 dans lequel R^1 est  .

5. Composé ou sel selon la revendication 4 dans lequel R^5 est  .

6. Composé selon la revendication 5, qui est une 6,6-diméthyl-2-{2-[(1-méthyl-1H-pyrazol-5-yl)amino]pyrimidin-4-yl}-5-[2-(morpholin-4-yl)éthyl]-5,6-dihydro-4H-thiéno[2,3-c]pyrrol-4-one ou son sel pharmaceutiquement acceptable.

7. Composé ou sel selon la revendication 6 qui est une 6,6-diméthyl-2-{2-[(1-méthyl-1H-pyrazol-5-yl)amino]pyrimidin-4-yl}-5-[2-(morpholin-4-yl)éthyl]-5,6-dihydro-4H-thiéno[2,3-c]pyrrol-4-one.

8. Composition pharmaceutique comprenant le composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 7, et un support, diluant, ou excipient pharmaceutiquement acceptable.

9. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 7 pour utilisation dans un traitement.

10. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 7 pour utilisation dans le traitement du cancer.

11. Composé ou sel selon la revendication 6, pour utilisation dans une administration simultanée séparée ou séquentielle en combinaison avec du ramucirumab dans le traitement du cancer.

12. Composé ou sel selon la revendication 6, pour utilisation dans une administration simultanée séparée ou séquentielle en combinaison avec de la [5-(4-éthyl-pipérazin-1-ylméthyl)-pyridin-2-yl]-[5-fluoro-4-(7-fluoro-3-isopropyl-2-méthyl-3H-benzoimidazol-5-yl)-pyrimidin-2-yl]-amine, ou son sel pharmaceutiquement acceptable dans le traitement du cancer.

13. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 10 à 12, dans lequel le cancer est sélectionné dans le groupe constitué d'un mélanome, d'un cancer colorectal, d'un cancer du pancréas, et d'un cancer du poumon non à petites cellules.

14. Composé ou sel selon la revendication 13, dans lequel le cancer est le cancer colorectal.

15. Composé ou sel selon la revendication 13, dans lequel le cancer est le cancer du pancréas.

16. Composé ou sel selon la revendication 13, dans lequel le cancer est le cancer du poumon non à petites cellules.