

## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 42107 B1** (51) Cl. internationale : **C07D 413/04**  
(43) Date de publication : **28.02.2020**

- 
- (21) N° Dépôt : **42107**  
(22) Date de Dépôt : **19.05.2016**  
(30) Données de Priorité : **20.05.2015 WO PCT/EP2015/061153**  
(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2016/061200 19.05.2016**  
(86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation:EP16724387.2  
(71) Demandeur(s) : **Idorsia Pharmaceuticals Ltd, Hegenheimermattweg 91 4123 Allschwil (CH)**  
(72) Inventeur(s) : **LESCOP, Cyrille**  
(74) Mandataire : **SABA & CO, TMP**
- 
- (54) Titre : **FORME CRISTALLINE DU COMPOSÉ (S)-3-{4-[5-(2-CYCLOPENTYL-6-MÉTHOXY-PYRIDIN-4-YL)-[1,2,4]OXADIAZOL-3-YL]-2-ÉTHYL-6-MÉTHYL-PHÉNOXY}-PROPANE-1,2-DIOL**  
(57) Abrégé : La présente invention concerne une forme cristalline du composé (S)-3-{4- [5-(2-cyclopentyl-6-méthoxy-pyridin-4-yl)-[1,2,4] oxadiazol-3-yl]-2-éthyl-6-méthyl-phénoxy}-propane-1,2-diol.

**Revendications**

1. Forme cristalline du composé qu'est le (S)-3-{4-[5-(2-cyclopentyl-6-méthoxy-pyridin-4-yl)-[1,2,4]oxadiazol-3-yl]-2-éthyl-6-méthyl-phénoxy}-propane-1,2-diol, caractérisée par la présence de raies sur le diagramme de diffraction des rayons X sur poudre aux angles de réfraction  $2\theta$  suivants :  $5,4^\circ$ ,  $8,5^\circ$  et  $10,8^\circ$ .
2. Forme cristalline selon la revendication 1, caractérisée par la présence de raies sur le diagramme de diffraction des rayons X sur poudre aux angles de réfraction  $2\theta$  suivants :  $4,2^\circ$ ,  $5,4^\circ$ ,  $8,0^\circ$ ,  $8,5^\circ$  et  $10,8^\circ$ .
3. Forme cristalline selon la revendication 1, caractérisée par la présence de raies sur le diagramme de diffraction des rayons X sur poudre aux angles de réfraction  $2\theta$  suivants :  $4,2^\circ$ ,  $5,4^\circ$ ,  $8,0^\circ$ ,  $8,5^\circ$ ,  $10,8^\circ$ ,  $12,7^\circ$ ,  $14,4^\circ$ ,  $17,7^\circ$ ,  $20,4^\circ$  et  $21,3^\circ$ .
4. Forme cristalline selon l'une quelconque des revendications 1 à 3 qui a un point de fusion, tel que déterminé par calorimétrie à balayage différentiel, de  $79^\circ\text{C} \pm 5^\circ\text{C}$ .
5. Composition pharmaceutique comprenant la forme cristalline selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 et un véhicule pharmaceutiquement acceptable.
6. Forme cristalline selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 ou composition pharmaceutique selon la revendication 5, pour une utilisation en tant que médicament.
7. Forme cristalline selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 ou composition pharmaceutique selon la revendication 5, pour une utilisation dans la prévention ou le traitement d'une maladie ou d'une affection associée à une activation du système immunitaire.
8. Forme cristalline selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 ou composition pharmaceutique selon la revendication 5, pour une utilisation dans la prévention ou le traitement d'une maladie ou d'une affection sélectionnée dans le groupe consistant en les suivantes : rejet d'organes transplantés comme un rein, un foie, un cœur, un poumon, un pancréas, une cornée et la peau ; maladie du greffon contre l'hôte ; syndromes auto-immuns, y compris syndrome de Sjögren, spondylarthropathie / spondylarthrite ankylosante, arthrite juvénile, lupus érythémateux subaigu, lupus érythémateux discoïde, néphropathie

- lupique, sclérodémie systémique, sclérodémie systémique cutanée diffuse, vascularite (p. ex. maladie de Wegener), artérite à cellules géantes, maladie de Behçet, uvéite non infectieuse, syndrome de Goodpasture, maladie de Graves, syndrome de Guillain-Barré, cirrhose biliaire primitive, cholangite sclérosante primitive, hépatite auto-immune,
- 5 polymyosite, dermatomyosite, colite microscopique, maladie coeliaque, sarcoïdose, vitiligo, pelade, polyradiculonévrite inflammatoire démyélinisante chronique (PIDC), encéphalite de Rasmussen, polyarthrite rhumatoïde, sclérose en plaques, maladies intestinales inflammatoires, comme la maladie de Crohn et la rectocolite hémorragique, psoriasis, rhumatisme psoriasique, thyroïdite, comme la thyroïdite de Hashimoto, uvéo-rétinite et
- 10 érythémateux aigu disséminé ; maladies atopiques comme la rhinite, la conjonctivite et l'eczéma atopique ; asthme ; diabète de type I ; et maladies auto-immunes post-infectieuses, y compris rhumatisme articulaire.
9. Forme cristalline selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 ou composition
- 15 pharmaceutique selon la revendication 5, pour une utilisation dans le traitement du lupus érythémateux aigu disséminé.