



## (12) BREVET D'INVENTION

(11) N° de publication : **MA 42602 B1** (51) Cl. internationale : **A61K 31/4439; C07D 401/12; A61P 25/06**

(43) Date de publication : **31.08.2021**

---

(21) N° Dépôt : **42602**

(22) Date de Dépôt : **05.08.2016**

(30) Données de Priorité : **12.08.2015 US 201562203996 P**

(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/US2016/045698 05.08.2016**

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

(72) Inventeur(s) : **COATES, David Andrew ; FORTNER, Kevin Charles ; MASSEY, Steven Marc ; MYERS, Jason Kenneth ; NAVARRO, Antonio ; SIEGEL, Miles Goodman ; STUCKY, Russell Dean**

(74) Mandataire : **H&H IP LAW**

(86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP16751123.7**

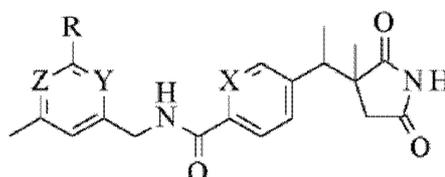
---

(54) Titre : **ANTAGONISTES DU RECEPTEUR CGRP**

(57) Abrégé : La présente invention concerne un composé de formule II : ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

## REVENDEICATIONS

1. Composé de formule :



5

dans laquelle

Y est CH ou N ;

Z est CH ou N ;

à condition que lorsque Y est CH, Z soit N et lorsque Y est N, Z soit CH ;

10 X est CH ou N ; et

R est un alkyle en C1-C3, un cycloalkyle en C3-C5 ou CN,

ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

2. Composé ou sel selon la revendication 1, dans lequel X est CH.

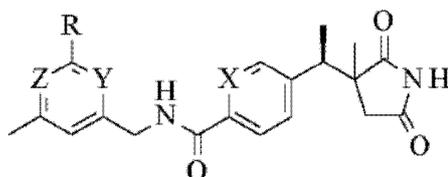
15

3. Composé ou sel selon l'une quelconque de la revendication 1 ou la revendication 2, dans lequel Y est CH et Z est N.

4. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 3, dans

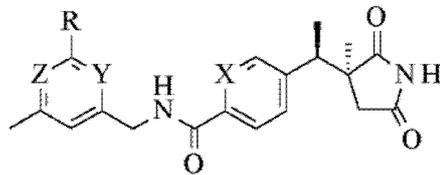
20 lequel R est un alkyle en C1-C3.

5. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 de formule :

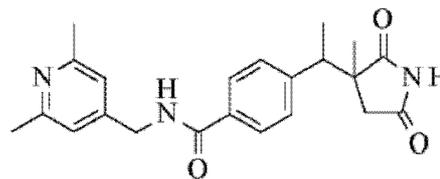


25

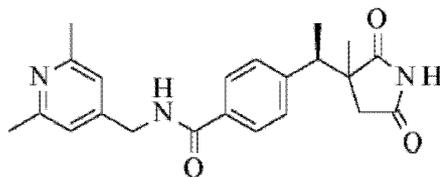
6. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 5 de formule :



5 7. Composé ou sel selon la revendication 1, dans lequel le composé est :

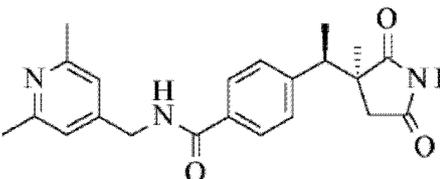


8. Composé ou sel selon la revendication 7, dans lequel le composé est :

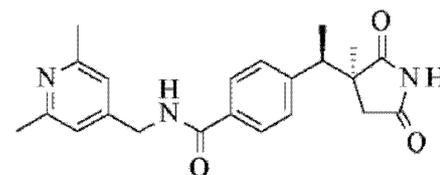


10

9. Composé ou sel selon la revendication 8, dans lequel le composé est :



10. Composé selon la revendication 9 qui est :



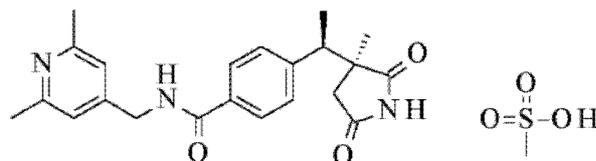
15

11. Composé selon la revendication 10 qui est un anhydrate cristallin caractérisé par un pic substantiel dans le spectre de diffraction des rayons X à

un angle de diffraction 2-thêta de 13,4 °, en combinaison avec un ou plusieurs des pics choisis dans le groupe constitué par 14,4 °, 18,1 °, 19,4 °, 20,9 °, 21,2 °, 21,5 ° et 26,5 °, avec une tolérance pour les angles de diffraction de 0,2 mesurés avec une source de CuK-alpha.

5

12. Sel selon la revendication 9 qui est :



10 13. Sel selon la revendication 12, qui est cristallin caractérisé par un pic substantiel dans le spectre de diffraction des rayons X à un angle de diffraction 2-thêta de 18,8 ° en combinaison avec un ou plusieurs des pics choisis dans le groupe constitué par 23,2 °, 24,7 ° et 15,2 ° ; avec une tolérance pour les angles de diffraction de 0,2 degré, mesurés avec une source de CuK-alpha.

15 14. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 13 pour une utilisation en thérapie.

15 15. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 13 pour une utilisation dans le traitement de la migraine.

20

16. Composé ou sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 13 pour une utilisation dans la prévention de la migraine.

25 17. Composition pharmaceutique, comprenant un composé ou un sel selon l'une quelconque des revendications 1 à 13 avec un ou plusieurs supports, diluants ou excipients pharmaceutiquement acceptables.

18. Procédé de préparation d'une composition pharmaceutique, comprenant le mélange d'un composé ou d'un sel selon l'une quelconque des

revendications 1 à 13 avec un ou plusieurs supports, diluants ou excipients pharmaceutiquement acceptables.