

(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 45665 B1** (51) Cl. internationale : **A61K 31/527; C07D 487/10; A61P 25/16**
- (43) Date de publication : **30.11.2020**

-
- (21) N° Dépôt : **45665**
- (22) Date de Dépôt : **12.07.2017**
- (30) Données de Priorité : **18.07.2016 EP 16179837**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2017/067495 12.07.2017**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: EP17742971.9
- (71) Demandeur(s) : **F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124 4070 Basel (CH)**
- (72) Inventeur(s) : **RUEHER, Daniel ; JAESCHKE, Georg ; RICCI, Antonio ; BIEMANS, Barbara ; O`HARA, Fionn**
- (74) Mandataire : **SABA & CO., TMP**

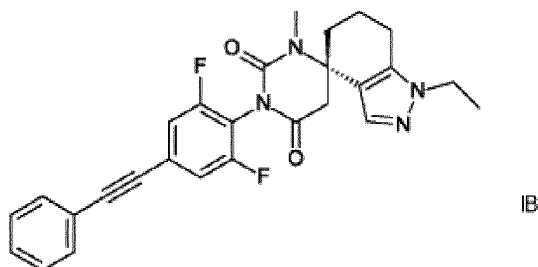
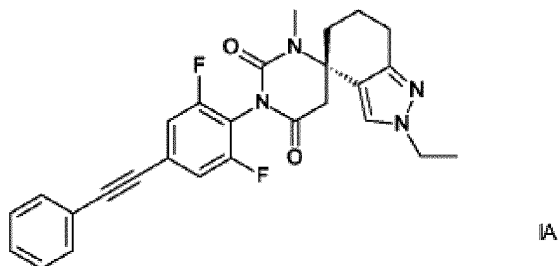
(54) Titre : **DÉRIVÉS D'ÉTHYNYLE**

- (57) Abrégé : La présente invention concerne des composés de formules IA et IB IA IB ou à un sel pharmaceutiquement accepté ou un sel d'addition acide, à un mélange racémique, ou à son énantiomère correspondant et/ou isomère optique et/ou stéréoisomère de celui-ci. Les composés peuvent être utilisés pour le traitement de la maladie de Parkinson, de l'anxiété, des vomissements, d'un trouble obsessionnel compulsif, de l'autisme, la neuroprotection, du cancer, de la dépression et du diabète de type 2.

DÉRIVÉS D'ÉTHYNYLE

Revendications

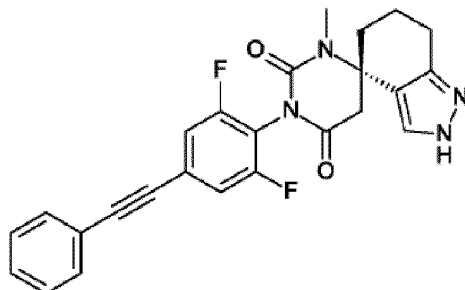
1. Composé de formules IA et IB



5 ou un sel ou sel d'addition d'acide pharmaceutiquement acceptable, un mélange racémique, ou son énantiomère et/ou isomère optique et/ou stéréoisomère correspondant.

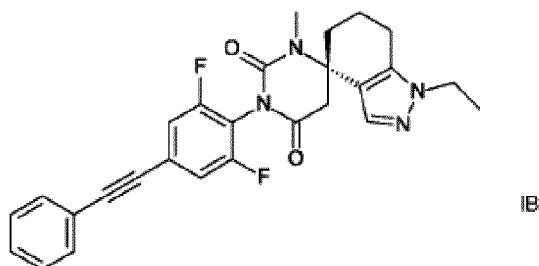
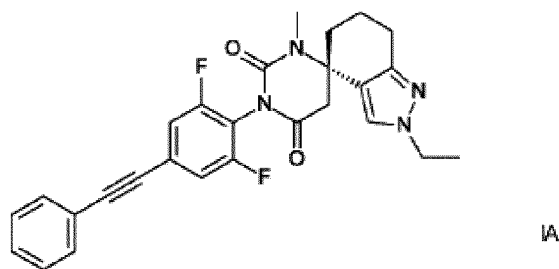
2. Procédé de fabrication du composé de formule IA ou IB tel que défini dans la revendication 1, lequel procédé comprend

l'alkylation d'un composé de formule



12

avec de l'iodure d'éthyle et la séparation des isomères en un composé de formules



ou, si souhaité, la conversion des composés obtenus en les sels pharmaceutiquement acceptables correspondants.

3. Composé de formule IA ou IB selon la revendication 1 pour une utilisation comme substances thérapeutiquement actives.

4. Composé de formule IA ou IB selon la revendication 1 pour une utilisation dans le traitement de la maladie de Parkinson, de l'anxiété, des vomissements, du trouble obsessionnel compulsif, de l'autisme, du cancer, de la dépression et du diabète de type 2.

5. Composition pharmaceutique comprenant un composé de formule IA ou IB selon la revendication 1 et des excipients pharmaceutiquement acceptables.