

(12) BREVET D'INVENTION

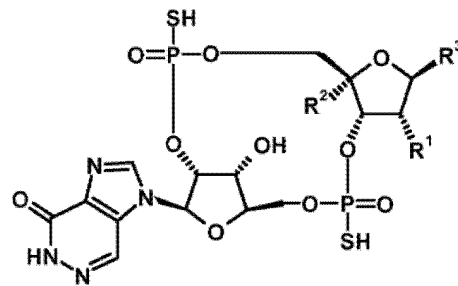
- (11) N° de publication : **MA 46325 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/7076; C07H 21/02; C07H 19/23; A61P 37/00**
- (43) Date de publication : **26.02.2021**
-
- (21) N° Dépôt : **46325**
- (22) Date de Dépôt : **28.09.2017**
- (30) Données de Priorité : **30.09.2016 EP 16191919**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2017/074608 28.09.2017**
- (71) Demandeur(s) : **Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173 55216 Ingelheim am Rhein (DE)**
- (72) Inventeur(s) : **OOST, Thorsten ; CAROTTA, Sebastian ; FLECK, Martin**
- (74) Mandataire : **SABA & CO.,TMP**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP17772731.0**

(54) Titre : **COMPOSÉS DINUCLÉOTIDIQUES CYCLIQUES**

(57) Abrégé : La présente invention concerne des composés de formule générale I, (I), dans laquelle les groupes R 1 , R 2 et R 3 sont tels que définis dans la revendication 1, qui présentent des propriétés pharmacologiques intéressantes, en particulier des modulateurs de STING.

REVENDICATIONS

1. Composé de formule I



I,

5

dans laquelle

R¹ est sélectionné parmi le groupe constitué de H, F,
-O-C₁₋₃alkyle et OH, et

10

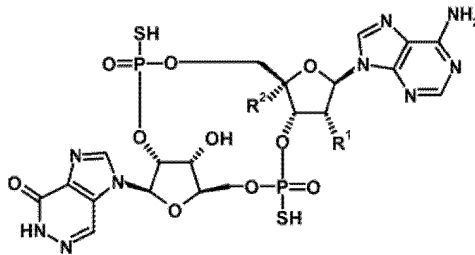
R² est H, ou

R² est -CH₂- et R¹ est -O-, formant ensemble un pont
-CH₂-O-, et

15 R³ est une nucléobase purine sélectionnée parmi le
groupe constitué de purine, d'adénine, de guanine, de
xanthine, d'hypoxanthine, reliée par l'intermédiaire de
son azote N⁹,

20 les solvates et hydrates de celui-ci, ou un sel de
celui-ci.

2. Composé de formule **Ia** selon la revendication 1

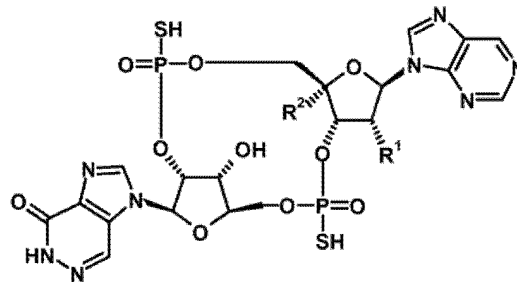


Ia,

les solvates et hydrates de celui-ci, ou un sel de celui-ci.

5

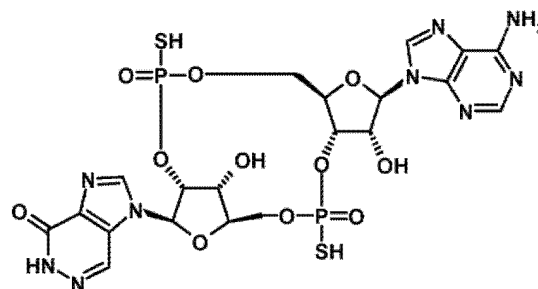
3. Composé de formule **Ib** selon la revendication 1,



Ib,

10 les solvates et hydrates de celui-ci, ou un sel de celui-ci.

4. Composé de formule Ia.1 selon la revendication 2

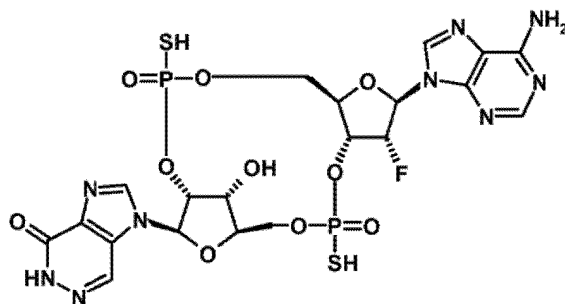


Ia.1,

15

les solvates et hydrates de celui-ci.

5. Composé de formule Ia.2 selon la revendication 2

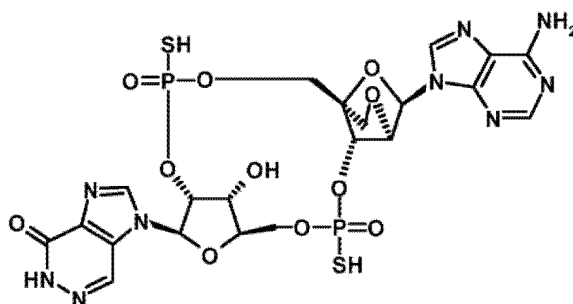


5

Ia.2,

les solvates et hydrates de celui-ci.

6. Composé de formule Ia.3 selon la revendication 2

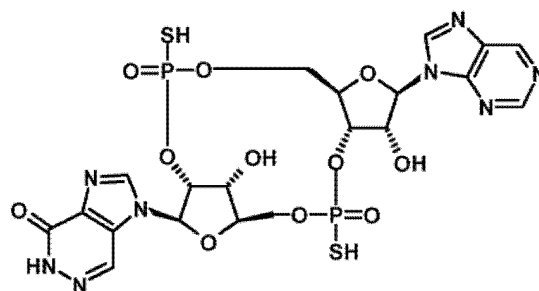


10

Ia.3,

les solvates et hydrates de celui-ci.

7. Composé de formule Ib.1 selon la revendication 3



15

Ib.1,

les solvates et hydrates de celui-ci.

8. Stéréoisomère (Sp,Sp), (Rp,Rp), (Sp,Rp) ou (Rp,Sp) sensiblement pur d'un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 7, qui est pur à au moins 90 % par rapport aux autres diastéréomères possibles, ou un sel de celui-ci.
9. Stéréoisomère (Rp,Rp) sensiblement pur d'un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 7, qui est pur à au moins 90 % par rapport aux autres diastéréomères possibles, ou un sel de celui-ci.
10. Sel pharmaceutiquement acceptable d'un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 9.
11. Sel de sodium d'un composé selon la revendication 4, 5, 6 ou 7.
12. Composition pharmaceutique comprenant un ou plusieurs composés selon l'une quelconque des revendications 1 à 9, ou un ou plusieurs sels pharmaceutiquement acceptables selon la revendication 10, optionnellement ensemble avec un ou plusieurs diluants et/ou supports inertes.
13. Vaccin comprenant un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 10.
14. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 10 pour son utilisation en tant qu'adjuvants de vaccin.

15. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 10 pour son utilisation en tant que médicament.
- 5 16. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 10 pour son utilisation dans le traitement de maladies ou d'affections sélectionnées parmi l'inflammation, les maladies allergiques, les maladies auto-immunes, les maladies infectieuses et le cancer.
- 10 17. Composition pharmaceutique comprenant un ou plusieurs composés selon l'une quelconque des revendications 1 à 10 et un ou plusieurs agents thérapeutiques additionnels, optionnellement ensemble
15 avec un ou plusieurs diluants et/ou supports inertes.
18. Composition pharmaceutique selon la revendication 17 comprenant un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 10 et un ou plusieurs agents
20 thérapeutiques additionnels.