

(12) BREVET D'INVENTION

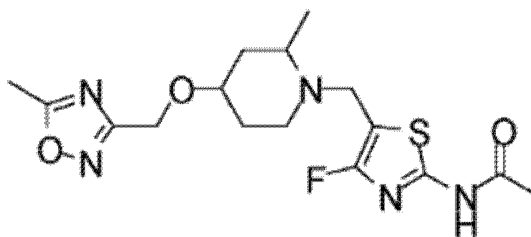
- (11) N° de publication : **MA 47368 B1** (51) Cl. internationale : **A61K 31/445; C07D 417/14; A61P 25/28; A61P 25/00**
- (43) Date de publication : **29.07.2021**

-
- (21) N° Dépôt : **47368**
- (22) Date de Dépôt : **19.01.2018**
- (30) Données de Priorité : **27.01.2017 US 201762451137 P**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/US2018/014331 19.01.2018**
- (71) Demandeur(s) : **Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center Indianapolis, IN 46285 (US)**
- (72) Inventeur(s) : **DREYFUS, Nicolas Jacques Francois ; LINDSAY-SCOTT, Peter James**
- (74) Mandataire : **H&H IP LAW**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP18703154.7**
-
- (54) Titre : **N-[4-FLUORO-5-[[[(2S,4S)-2-MÉTHYL-4-[(5-MÉTHYL-1,2,4-OXADIAZOL-3-YL)MÉTHOXY]-1-PIPÉRIDYL]MÉTHYL]THIAZOL-2-YL]ACÉTAMIDE UTILISÉS EN TANT QU'INHIBITEUR D'OGA**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne un composé de formule (I) : ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci ainsi que l'utilisation de composés de formule (I) pour le traitement de maladies et de troubles neurodégénératifs, tels que la maladie d'Alzheimer.

N-[4-FLUORO-5-[[[(2S,4S)-2-MÉTHYL-4-[(5-MÉTHYL-1,2,4-OXADIAZOL-3-YL)MÉTHOXY]-1-PIPÉRIDYL]MÉTHYL]THIAZOL-2-YL]ACÉTAMIDE UTILISÉS EN TANT QU'INHIBITEUR D'OGA

REVENDEICATIONS

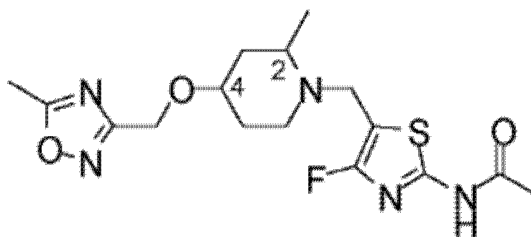
1. Composé de formule :



ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

5

2. Composé ou sel selon la revendication 1, dans lequel le méthyle en position 2 est en configuration *cis* par rapport à l'oxygène en position 4 sur le cycle pipéridine :



10

3. Composé ou sel selon l'une quelconque de la revendication 1 ou de la revendication 2, le composé étant le N-[4-fluoro-5-[[[(2S,4S)-2-méthyl-4-[(5-méthyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl)méthoxy]-1-pipéridyl]méthyl]thiazol-2-yl]acétamide.

15

4. Composé selon la revendication 3, qui est le N-[4-fluoro-5-[[[(2S,4S)-2-méthyl-4-[(5-méthyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl)méthoxy]-1-pipéridyl]méthyl]thiazol-2-yl]acétamide.

5. Composé selon la revendication 4, le composé étant cristallin.

6. Composé selon la revendication 5, qui est caractérisé par un pic dans le spectre de diffraction des rayons X sur poudre, à un angle de diffraction 2-thêta de 12,1 ° en combinaison avec un ou plusieurs pics choisis dans le groupe constitué par 15,3 °, 21,6 °, 22,2 °, 22,7 °, 23,5 °, 24,3 ° et 26,8 °, avec une tolérance pour les angles de diffraction de 0,2 degré.

7. Composé ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci selon l'une quelconque des revendications 1 à 6 pour utilisation en thérapie.

8. Composé ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci selon l'une quelconque des revendications 1 à 6 pour utilisation dans le traitement de la maladie d'Alzheimer.

9. Composé ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci selon l'une quelconque des revendications 1 à 6 pour utilisation dans le traitement de l'évolution d'un trouble cognitif léger vers la maladie d'Alzheimer.

10. Composé ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci selon l'une quelconque des revendications 1 à 6 pour utilisation dans le traitement de la paralysie supranucléaire évolutive.

11. Composition pharmaceutique, comprenant un composé ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci selon l'une quelconque des revendications 1 à 6 avec un ou plusieurs supports, diluants ou excipients pharmaceutiquement acceptables.

12. Procédé de préparation d'une composition pharmaceutique, comprenant le mélange d'un composé ou d'un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci selon l'une quelconque des revendications 1 à 6 avec un ou plusieurs supports, diluants ou excipients pharmaceutiquement acceptables.