

(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 47498 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/216; A61K 31/7048; A61P 3/10; A61P 3/06; A61P 3/04**
- (43) Date de publication : **31.08.2021**
-
- (21) N° Dépôt : **47498**
- (22) Date de Dépôt : **13.02.2018**
- (30) Données de Priorité : **16.02.2017 FR 1770144**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2018/053520 13.02.2018**
- (71) Demandeur(s) :
- Valbiotis, Rue Paul Vatine ZI des quatre Chevaliers, Bâtiment 12 F 17180 Perigny (FR)
 - CNRS, 3, rue Michel Ange 75794 Paris Cedex 16 (FR)
 - Université Clermont Auvergne, 49, Boulevard François Mitterrand 63000 Clermont-Ferrand (FR)
 - La Rochelle Université, 23 avenue Albert Einstein 17071 La Rochelle Cedex 9 (FR)
- (72) Inventeur(s) : **PELTIER, Sébastien ; SIRVENT, Pascal ; MAUGARD, Thierry ; CHAVANELLE, Vivien ; LE JOUBIOUX, Florian**
- (74) Mandataire : **H&H IP LAW**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP18708058.5**
-
- (54) Titre : **PRINCIPE ACTIF PHARMACEUTIQUE ET UTILISATION EN PARTICULIER DANS LA PREVENTION ET LE TRAITEMENT DES DEREGLEMENTS METABOLIQUES CHEZ L'HOMME ET L'ANIMAL**
- (57) Abrégé : L'objet de l'invention est un principe actif pharmaceutique constitué exclusivement par l'association de l'acide (1S,3R,4R,5R)-3-[[[(2E)-3-(3,4-dihydroxyphényl)-2-propenoyl]oxy]- 1,4,5-trihydroxycyclohexanecarboxylique et du (2S,3E,4S)-4-{2-[2-(3,4- Dihydroxyphényl)éthoxy]-2-oxoéthyl]-3-éthylidène-2-(P-D-glucopyranosyloxy)-3,4-dihydro- 2H-pyrane-5-carboxylate de méthyle pour une utilisation comme médicament ou produit vétérinaire, en particulier dans la prévention et/ou le traitement des dérèglements pathologiques du métabolisme glucidique et/ou lipidique.

Revendications

1. Principe actif pharmaceutique constitué exclusivement par l'association :

- de l'acide (1S,3R,4R,5R)-3-[[[(2E)-3-(3,4-dihydroxyphényl)-2-propenoyl]oxy]-1,4,5-trihydroxycyclohexanecarboxylique, et
 - du (2S,3E,4S)-4-{2-[2-(3,4-Dihydroxyphényl)éthoxy]-2-oxoéthyl}-3-éthylidène-2-(β-D-glucopyranosyloxy)-3,4-dihydro-2H-pyrane-5-carboxylate de méthyle,
- pour une utilisation comme médicament ou produit vétérinaire.

2. Principe actif pharmaceutique pour une utilisation selon la revendication 1, dans la prévention et/ou le traitement d'au moins une maladie choisie parmi le diabète de type 2, les maladies du foie gras non alcoolique, les pathologies cardiovasculaires, la dyslipidémie, l'obésité et le syndrome métabolique.

3. Principe actif pharmaceutique pour une utilisation selon la revendication 2, **caractérisée en ce que** les pathologies cardiovasculaires sont choisies parmi les cardiopathies coronariennes, les maladies cérébro-vasculaires, les artériopathies périphériques et les thromboses veineuses profondes.

4. Principe actif pharmaceutique pour une utilisation selon la revendication 2, **caractérisée en ce que** la maladie du foie gras non alcoolique est la stéatose hépatique non alcoolique.

5. Principe actif pharmaceutique pour une utilisation selon l'une des précédentes revendications, **caractérisé en ce que** le ratio acide (1S,3R,4R,5R)-3-[[[(2E)-3-(3,4-dihydroxyphényl)-2-propenoyl]oxy]-1,4,5-trihydroxycyclohexanecarboxylique sur (2S,3E,4S)-4-{2-[2-(3,4-Dihydroxyphényl)éthoxy]-2-oxoéthyl}-3-éthylidène-2-(β-D-glucopyranosyloxy)-3,4-dihydro-2H-pyrane-5-carboxylate de méthyle en poids est compris entre 1/40 et 1/1.

6. Principe actif pharmaceutique pour une utilisation selon l'une des précédentes revendications, **caractérisé en ce que** les molécules de l'acide (1S,3R,4R,5R)-3-[[[(2E)-3-(3,4-dihydroxyphényl)-2-propenoyl]oxy]-1,4,5-trihydroxycyclohexanecarboxylique et de (2S,3E,4S)-4-{2-[2-(3,4-Dihydroxyphényl)éthoxy]-2-oxoéthyl}-3-éthylidène-2-(β-D-glucopyranosyloxy)-3,4-dihydro-2H-pyrane-5-carboxylate de méthyle sont des molécules naturelles ou de synthèse par un procédé chimique et/ou biotechnologique.

7. Principe actif pharmaceutique pour une utilisation selon l'une des précédentes revendications, **caractérisé en ce qu'il se présente** sous forme solide ou liquide.

8. Principe actif pharmaceutique pour une utilisation selon l'une des précédentes revendications par voie orale, entérale, parentérale ou sous-cutanée.

9. Principe actif pharmaceutique pour une utilisation selon l'une des précédentes revendications au sein d'une composition pharmaceutique.

10. Composition pharmaceutique comprenant un principe actif pharmaceutique selon l'une des précédentes revendications pour une utilisation selon l'une des précédentes revendications,

caractérisée en ce qu'elle se présente sous forme de comprimés, capsules, gélules, poudre, sachets, ampoules, solution pour compte-goutte ou solution injectable.

11. Composition pharmaceutique pour une utilisation selon la revendication 10, **caractérisée en ce qu'**elle comprend entre 0,5 et 100% du principe actif pharmaceutique en poids de matière sèche.