

## (12) BREVET D'INVENTION

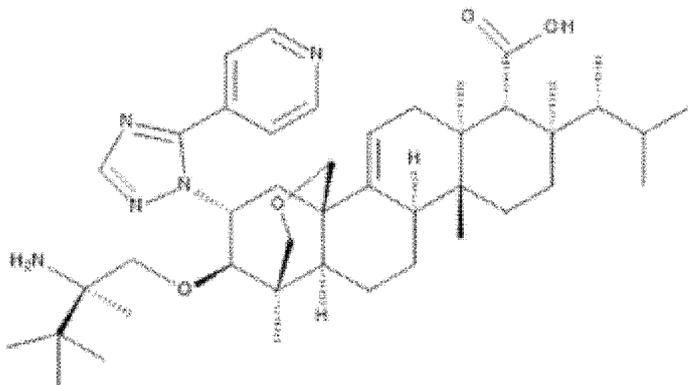
- (11) N° de publication : **MA 49751 B1** (51) Cl. internationale : **A61K 31/4196; A61P 31/10; A61P 15/02; A61K 31/4439**
- (43) Date de publication : **30.12.2022**

- 
- (21) N° Dépôt : **49751**
- (22) Date de Dépôt : **31.07.2018**
- (30) Données de Priorité : **04.08.2017 US 201762541370 P**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/US2018/044619 31.07.2018**
- (71) Demandeur(s) : **Scynexis, Inc., 1 Evertrust Plaza, 13th Floor Jersey City, NJ 07302 (US)**
- (72) Inventeur(s) : **ANGULO GONZALEZ, David A.**
- (74) Mandataire : **ATLAS INTELLECTUAL PROPERTY**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: EP18755632.9**

- 
- (54) Titre : **AGENTS ANTIFONGIQUES À ACTIVITÉ AMÉLIORÉE EN PH ACIDE**
- (57) Abrégé : Les composés antifongiques triterpénoïdes dérivés de l'enfumafungine sont utilisés pour traiter ou prévenir les infections fongiques se produisant en ou sous conditions acides, où le pH est inférieur à environ 7, du fait que leur efficacité est, de façon inattendue, améliorée sous de telles conditions. Les triterpénoïdes dérivés de l'enfumafungine (ou des sels ou hydrates de qualité pharmaceutique de ces derniers) sont des inhibiteurs de la synthèse des (1,3)-β-D-glucanes et sont utilisables dans le traitement ou la prévention d'infections à levures ou à champignons filamenteux qui se développent dans les zones anatomiques à pH bas, telles que la cavité vaginale, ou sous des conditions d'environnement local acides telles que celles observées dans des abcès fongiques, dans l'empyème, ou dans les infections du tractus gastro-intestinal supérieur.

## Revendications

1. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation dans un procédé de traitement ou de prévention d'une infection de type candidose vulvovaginale (VVC) chez un sujet qui en a besoin, le procédé comprenant l'administration au sujet d'un composé de formule (IIa) ou d'un sel pharmaceutiquement acceptable correspondant :



(IIa)

le composé étant l'acide (1S,4aR,6aS,7R,8R,10aR,10bR,12aR,14R,15R)-15-[[[(2R)-2-amino-2,3,3-triméthylbutyl]oxy]-8-[(1R)-1,2-diméthylpropyl]-14-[5-(4-pyridinyl)-1H-1,2,4-triazol-1-yl]-1,6,6a,7,8,9,10,10a,10b,11,12,12a dodécahydro-1,6a,8,10a-tétraméthyl-4H-1,4a-propano-2H-phénanthro[1,2-c]pyranne-7-carboxylique.

Le composé ou le sel pharmaceutiquement acceptable du composé étant administré à raison d'une dose quotidienne totale de 150 à 600 mg du composé, l'infection de type VVC ayant lieu dans une affection ou une zone anatomique dans laquelle le pH est inférieur à environ 5.

2. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation selon la revendication 1, le composé ou sel pharmaceutiquement acceptable du composé étant administré à raison d'une dose quotidienne totale de 300 à 600 mg du composé.

3. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation selon la revendication 1 ou 2, le composé ou sel pharmaceutiquement acceptable du composé étant administré BID (deux fois par jour) à raison d'une dose de 150 à 300 mg du composé deux fois par jour, pour une dose totale de 300 mg à 600 mg du composé.

4. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation selon la revendication 1, le composé ou sel pharmaceutiquement acceptable du composé étant administré à raison d'une dose quotidienne totale de 150 mg, d'une dose quotidienne totale de 300 mg, ou d'une dose quotidienne totale de 600 mg du composé.

5. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, le composé ou sel pharmaceutiquement acceptable du composé étant administré à raison d'une dose quotidienne totale de 600 mg du composé.

6. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, le sel de citrate du composé de formule (IIa) étant administré.

7. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 6, le composé ou sel pharmaceutiquement acceptable du composé étant administré oralement.

8. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 7, le composé ou sel pharmaceutiquement acceptable du composé étant administré oralement dans un comprimé.

9. Composé de formule (IIa) ou sel pharmaceutiquement acceptable correspondant, pour une utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 6, le composé ou sel pharmaceutiquement acceptable du composé étant administré de manière topique.