



(12) BREVET D'INVENTION

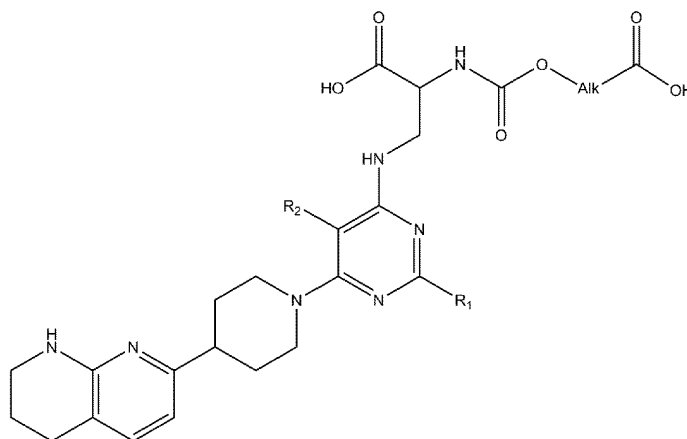
- (11) N° de publication : **MA 51342 B1** (51) Cl. internationale : **A61K 31/506; A61K 45/06; C07D 471/04; A61P 35/00; A61P 27/02**
- (43) Date de publication : **31.12.2020**

-
- (21) N° Dépôt : **51342**
- (22) Date de Dépôt : **19.08.2019**
- (30) Données de Priorité : **13.09.2018 EP 18194258**
- (71) Demandeur(s) : **Oxurion NV, Gaston Geenslaan 1 3001 Leuven (BE)**
- (72) Inventeur(s) : **PEDERSEN, Ove ; VERMASSEN, Elke**
- (74) Mandataire : **SABA & CO., TMP**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: EP19192402.6

-
- (54) Titre : **ANTAGONISTES D'INTÉGRINE**
- (57) Abrégé : The present invention relates to novel integrin antagonists of Formula I and their use as a medicament, in particular for inhibiting neovascularization.

Revendications

1. Composé selon la formule (I), ou sel pharmaceutiquement acceptable, solvate pharmaceutiquement acceptable, isomère ou mélange de ceux-ci,



5

Formule I

dans lequel

R₁ et R₂ sont indépendamment sélectionnés dans le groupe constitué d'hydrogène, de méthyle et d'éthyle ; et

10

Alk est de l'alkylène en C₁₋₄.

2. Composé selon la revendication 1, dans lequel R₁ et R₂ sont tous les deux du méthyle.

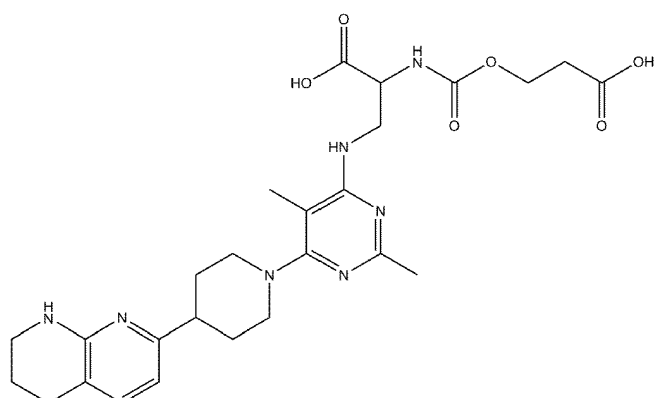
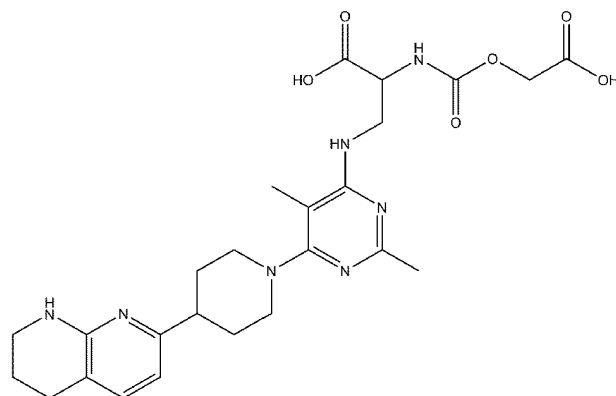
3. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 ou 2, dans lequel Alk est un alkylène en C₁ ou C₂.

15

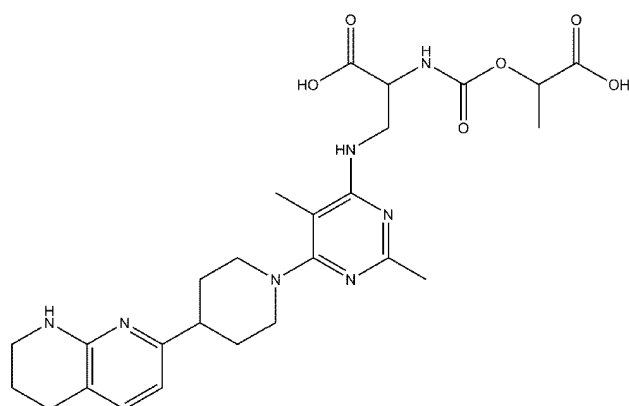
4. Composé selon l'une quelconque des revendications précédentes, dans lequel le composé est sélectionné dans le groupe constitué de :

2

EP3613739



; et



5 5. Composition pharmaceutique comprenant le composé selon l'une quelconque des revendications précédentes, et un ou plusieurs véhicules pharmaceutiquement acceptables.

6. Composé pharmaceutique selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, pour utilisation en tant que médicament.

10 7. Composé pour utilisation selon la revendication 6, pour utilisation dans l'inhibition de la néovascularisation.

8. Composé pour utilisation selon la revendication 6, pour utilisation dans le traitement et/ou la prévention du cancer.

9. Composé pour utilisation selon la revendication 6, pour utilisation dans le traitement et/ou la prévention d'un trouble ophtalmique.

5 10. Composé pour utilisation selon la revendication 9, dans lequel ledit trouble ophtalmique est sélectionné dans le groupe constitué de la dégénérescence maculaire humide liée à l'âge, du décollement de la rétine, de l'uvéite postérieure, de la néovascularisation cornéenne, de la néovascularisation de l'iris, de l'œdème maculaire diabétique, et de la rétinopathie diabétique.

10 11. Composé pour utilisation selon la revendication 9 ou 10, dans lequel le traitement et/ou la prévention comprennent l'administration du composé par injection intravitréenne.

15 12. Composé pour utilisation selon l'une quelconque des revendications 7 à 10, dans lequel l'inhibition, le traitement ou la prévention comprend en outre l'administration d'un composé qui se lie à et inhibe l'activité du facteur de croissance endothélial vasculaire (VEGF) ou d'un récepteur de VEGF.

13. Combinaison comprenant le composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 ; et un composé qui se lie à et empêche l'activité du facteur de croissance endothélial vasculaire (VEGF) ou d'un récepteur de VEGF.

20 14. Combinaison selon la revendication 13, pour l'utilisation selon l'une quelconque des revendications 6 à 11.