

(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 53124 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/436; C07D 491/052; A61P 35/00**
- (43) Date de publication : **28.02.2023**
-
- (21) N° Dépôt : **53124**
- (22) Date de Dépôt : **11.07.2019**
- (30) Données de Priorité : **12.07.2018 US 201862697100 P**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/US2019/041334 11.07.2019**
- (71) Demandeur(s) : **Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center Indianapolis, IN 46285 (US)**
- (72) Inventeur(s) : **MCMAHON, Jennifer Anne ; RUBIO, Almudena ; BASTIAN, Jolie Anne ; COHEN, Jeffrey Daniel ; SALL, Daniel Jon**
- (74) Mandataire : **H&H IP LAW**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP19745925.8**
-
- (54) Titre : **AGENTS DE DÉGRADATION SÉLECTIFS DES RÉCEPTEURS DES OESTROGÈNES**
- (57) Abrégé : L'invention concerne de nouveaux agents de dégradation sélectifs des récepteurs des oestrogènes (SERD) selon la formule : , des sels pharmaceutiquement acceptables de ceux-ci, et des compositions pharmaceutiques de ceux-ci, formule dans laquelle l'un parmi R1 et R2 est indépendamment choisi parmi Cl, F, -CF3 ou -CH3, et l'autre est l'hydrogène, et des procédés pour leur utilisation.

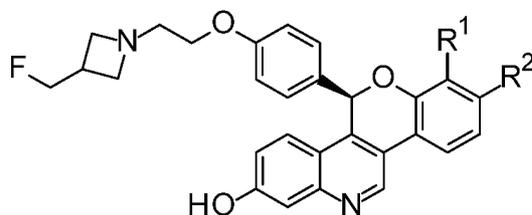
**AGENTS DE DÉGRADATION SÉLECTIFS DES RÉCEPTEURS DES
OESTROGÈNES****REVENDEICATIONS**

1. Composé de formule :



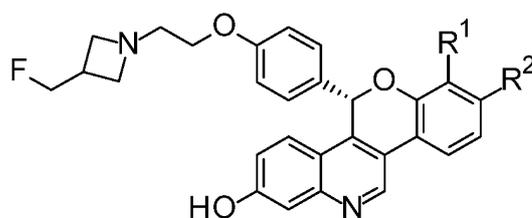
- soit R¹ soit R² étant indépendamment sélectionné parmi Cl, F, -CF₃, ou -CH₃, et l'autre étant un atome d'hydrogène, ou son sel pharmaceutiquement acceptable.

2. Composé selon la revendication 1, le composé étant



- ou son sel pharmaceutiquement acceptable.

3. Composé selon la revendication 1, le composé étant



- ou son sel pharmaceutiquement acceptable.

EP3820873 / 19745925.8

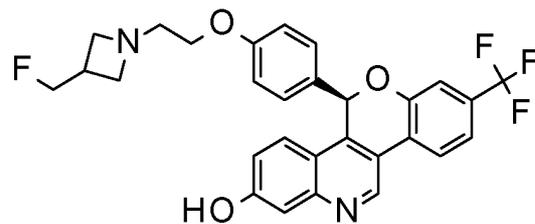
2

4. Composé selon la revendication 2, le composé étant

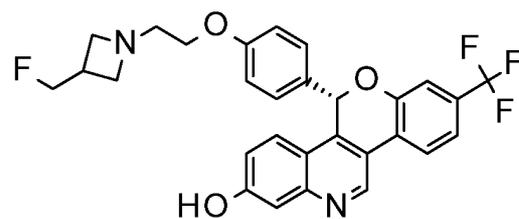


ou son sel pharmaceutiquement acceptable.

5. Composé selon la revendication 4, le composé étant



6. Composé selon la revendication 3, le composé étant



ou son sel pharmaceutiquement acceptable.

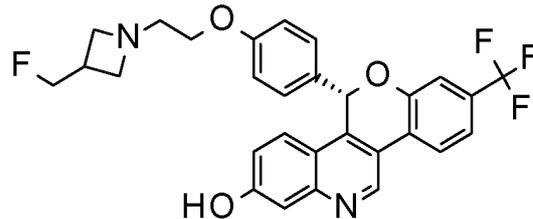
7. Composé selon la revendication 4 ou 6, le sel pharmaceutiquement acceptable étant un sel d'acide benzènesulfonique.

EP3820873 / 19745925.8

3

8. Composé selon la revendication 4 ou 6, le sel pharmaceutiquement acceptable étant un sel d'acide 4-méthylbenzène sulfonique.

9. Composé selon la revendication 6, le composé étant



10. Composition pharmaceutique comprenant le composé ou son sel pharmaceutiquement acceptable selon l'une quelconque des revendications 1 à 9 en combinaison avec un excipient, un support, ou un diluant pharmaceutiquement acceptable.

11. Composition pharmaceutique selon la revendication 10, comprenant un ou plusieurs autres agents thérapeutiques.

12. Composé ou son sel pharmaceutiquement acceptable ou composition pharmaceutique selon l'une quelconque des revendications 1 à 11 pour l'utilisation en thérapie.

13. Composé ou son sel pharmaceutiquement acceptable selon l'une quelconque des revendications 1 à 9 pour l'utilisation dans le traitement du cancer du sein, du cancer de l'ovaire, du cancer de l'endomètre, du cancer de la prostate, du cancer de l'utérus, du cancer de l'estomac, ou du cancer du poumon.

14. Composé ou son sel pour l'utilisation selon la revendication 13, dans le traitement du cancer du sein ER-positif.

EP3820873 / 19745925.8

4

15. Composé ou son sel pour l'utilisation selon la revendication 13, dans le traitement du cancer de l'estomac ER-positif.

16. Composé ou son sel pour l'utilisation selon la revendication 13, dans le traitement du cancer du poumon ER-positif.