

## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 53126 B1** (51) Cl. internationale : **A61K 31/436; C07D 491/052; A61P 35/00**
- (43) Date de publication : **28.02.2023**

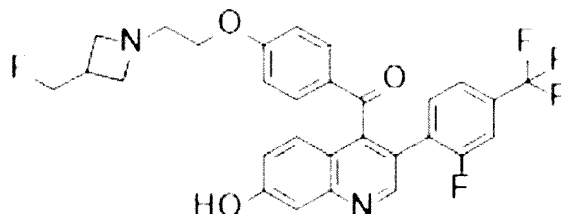
- 
- (21) N° Dépôt : **53126**
- (22) Date de Dépôt : **11.07.2019**
- (30) Données de Priorité : **12.07.2018 US 201862697100 P**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/US2019/041342 11.07.2019**
- (71) Demandeur(s) : **Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center Indianapolis, IN 46285 (US)**
- (72) Inventeur(s) : **COHEN, Jeffrey Daniel ; SALL, Daniel Jon**
- (74) Mandataire : **H&H IP LAW**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP19746252.6**
- 
- (54) Titre : **AGENTS DE DÉGRADATION SÉLECTIFS DU RÉCEPTEUR DES OESTROGÈNES**
- (57) Abrégé : L'invention concerne de nouveaux agents de dégradation sélectifs du récepteur des oestrogènes (SERD) selon la formule , des sels pharmaceutiquement acceptables, des compositions pharmaceutiques, des utilisations et des procédés d'utilisation de ceux-ci.

## AGENTS DE DÉGRADATION SÉLECTIFS DU RÉCEPTEUR DES OESTROGÈNES

### REVENDEICATIONS

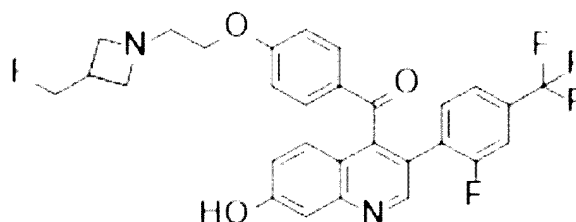
5

1. Composé de formule



ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

- 10 2. Composé selon la revendication 1, dans lequel le composé est



- 15 3. Composition pharmaceutique comprenant un composé de la revendication 1 ou la revendication 2, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, en combinaison avec un ou plusieurs excipients, supports ou diluants pharmaceutiquement acceptables.

4. Composition pharmaceutique selon la revendication 3, comprenant en outre un ou plusieurs agents thérapeutiques additionnels.

20

5. Composé de la revendication 1 ou la revendication 2, ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation en thérapie.

- 25 6. Composé de la revendication 1 ou la revendication 2, ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une 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 gastrique ou du cancer du poumon.

- 5 7. Composé, ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon la revendication 6, dans lequel le composé doit être administré par voie orale.
8. Composé pour une utilisation selon la revendication 7, ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, dans lequel le cancer du sein est un cancer du sein ER positif.
- 10
9. Composé pour une utilisation selon la revendication 7, ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, dans lequel le cancer gastrique est un cancer gastrique ER positif.
- 15
10. Composé pour une utilisation selon la revendication 7, ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, dans lequel le cancer du poumon est un cancer du poumon ER positif.
- 20
11. Procédé de préparation du 5-(4-{2-[3-(fluorométhyl)azétidin-1-yl]éthoxy}phényl)-8-(trifluorométhyl)-5H-[1]benzopyrano[4,3-c]quinoléin-2-ol, comprenant le refroidissement d'une solution de (4-{2-[3-(fluorométhyl)azétidin-1-yl]éthoxy}phényl){3-[2-fluoro-4-(trifluorométhyl)phényl]-7-hydroxyquinoléin-4-yl}méthanone dans du 1,4-dioxane à environ 5 °C puis l'ajout de triéthylborohydrure de lithium.
- 25
12. Produit du procédé de la revendication 11, dans lequel le produit est le 5-(4-{2-[3-(fluorométhyl)azétidin-1-yl]éthoxy}phényl)-8-(trifluorométhyl)-5H-[1]benzopyrano[4,3-c]quinoléin-2-ol.
- 30

13. Composition pharmaceutique selon la revendication 4, dans laquelle l'agent thérapeutique additionnel est le 5-(4-{2-[3-(fluorométhyl)azétidin-1-yl]éthoxy}phényl)-8-(trifluorométhyl)-5H-[1]benzopyrano[4,3-c]quinoléin-2-ol.