

## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 56525 B1** (51) Cl. internationale :  
**A61K 31/41; A61K 31/4192;**  
**A61K 31/4402; C07D 413/06;**  
(43) Date de publication : **29.02.2024** **A61K 31/506; A61P 35/00;**  
**A61K 31/497**

- 
- (21) N° Dépôt :  
**56525**
- (22) Date de Dépôt :  
**16.06.2020**
- (30) Données de Priorité :  
**18.06.2019 US 201962863199 P**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:  
**PCT/IB2020/055589 16.06.2020**
- (71) Demandeur(s) :  
• **Pfizer Inc., 66 Hudson Boulevard East New York, NY 10001-2192 (US)**  
• **CTXT PTY LTD, 305 Grattan Street Parkville Melbourne, VIC 3000 (AU)**
- (72) Inventeur(s) :  
**KUMPF, Robert Arnold ; KUNG, Pei-Pei ; SUTTON, Scott Channing ; GREASLEY, Samantha Elizabeth ; HOFFMAN, Robert Louis ; RICHARDSON, Paul Francis ; BOZIKIS, Ylva Elisabet Bergman ; BRODSKY, Oleg ; CAMERINO, Michelle Ang ; STUPPLE, Paul Anthony**
- (74) Mandataire :  
**CABINET CHARDY-PATENTMARK**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation : EP 20743773.2

- 
- (54) Titre : **DÉRIVÉS DE BENZISOXAZOLE SULFONAMIDE**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne des composés de formule (I) ou des sels pharmaceutiquement acceptables de ceux-ci, dans laquelle le cycle A, R1-R8 et n ont la signification indiquée dans la description. Les nouveaux dérivés de benzisoxazole sulfonamide sont utiles dans le traitement d'une croissance cellulaire anormale, telle que le cancer, chez des patients. D'autres modes de réalisation concernent des compositions pharmaceutiques contenant les composés et des méthodes d'utilisation des composés et des compositions dans le traitement d'une croissance cellulaire anormale chez des patients.

**POUVOIR  
POWER OF ATTORNEY**

Le(s) soussigné(s) : **CTXT PTY LTD**

*The undersigned :* **305 Grattan Street  
Parkville  
Melbourne, VIC 3000 / AU**

Donne pouvoir à: **CHARDY-PATENTMARK S.A.R.L.**  
*Hereby constitute and appoint* **22 rue Youssef Ben Tachfine  
RABAT-MAROC**

Pour nous et en notre nom, faire toutes les démarches nécessaires pour la protection de nos droits de Propriété Industrielle au Maroc y compris les procédures d'opposition.

*Special attorney for us and in our name and stead to take all necessary steps to secure our Industrial Property matters in Morocco, including opposition*

Validation de la demande de brevet européen N° **20743773.2** - N° de publication : **3986890**

En conséquence, signer et déposer toutes les pièces ou registres; verser ou retirer toutes les taxes; remplir toutes les formalités légales; présenter toute demande relative à des additions et perfectionnements; donner toutes décharges; élire domicile; recevoir l'expédition des titres; procès verbaux, etc...; nommer des sous-mandataires et, en général, remplir toutes les formalités voulues par les lois.

*In consequence to sign and register all the documents or registers: to pay or withdraw all the charges; to comply with all the legal formalities; to submit any application relating to additions and improvements; to give any discharges; to elect domicile, to receive the authentic copy of titles, certificates of filing etc...; to appoint sub-authorized agents and, in general, to comply with all the formalities required by the laws.*

Fait à ....., le.....

Done at Sydney, Australia, this 30 November 2023

CTXT PTY LTD



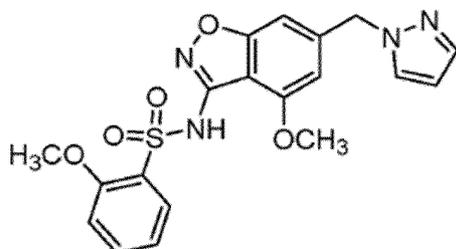
Alan D. Robertson, Company Director,  
Authorized Officer of CTXT PTY LTD

*Indiquer nom, prénom et qualité du signataire  
Mention full name and title of signatory*

*Dispensé de timbre et de légalisation  
No legalisation is required*

REVENDICATIONS

1. Composé qui est



ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci.

2. Composé selon la revendication 1, qui est le 2-  
5 méthoxy-*N*-{4-méthoxy-6-[(1*H*-pyrazol-1-yl)méthyl]-1,2-  
benzoxazol-3-yl}benzène-1-sulfonamide.

3. Composition pharmaceutique comprenant un composé  
selon l'une quelconque des revendications précédentes, ou un  
sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, et un  
10 véhicule ou un diluant pharmaceutiquement acceptable.

4. Composé selon l'une quelconque des revendications 1-  
2, ou sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour  
utilisation dans le traitement du cancer chez un patient.

5. Composé pour utilisation selon la revendication 4,  
15 dans lequel le cancer est choisi parmi le cancer du sein, du  
poumon, de la prostate, du pancréas, ou de l'ovaire.

6. Composé pour utilisation selon la revendication 4,  
dans lequel le cancer est un cancer du sein.

7. Composé pour utilisation selon la revendication 4,  
20 dans lequel le cancer est un cancer du sein ER positif.

8. Composé pour utilisation selon la revendication 4,  
dans lequel le cancer est un cancer du sein ER+ HER2-.

9. Composé pour utilisation selon la revendication 4,  
dans lequel le cancer est un cancer du sein ER+ HER2-  
25 localement avancé ou métastatique.

10. Composé pour utilisation selon la revendication 4, dans lequel le cancer est un cancer du poumon non à petites cellules.

5 11. Composé pour utilisation selon la revendication 4, dans lequel le cancer est un cancer du poumon non à petites cellules localement avancé ou métastatique.

12. Composé pour utilisation selon la revendication 4, dans lequel le cancer est un cancer de la prostate résistant à la castration.

10 13. Composé pour utilisation selon la revendication 4, dans lequel le cancer est un cancer de la prostate résistant à la castration localement avancé ou métastatique.

15 14. Combinaison d'un composé selon l'une quelconque des revendications 1-2, ou d'un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, avec un agent antitumoral ou avec une radiothérapie, pour utilisation dans le traitement du cancer.

20 15. Combinaison d'un composé selon l'une quelconque des revendications 1-2, ou d'un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, avec un agent antitumoral, pour utilisation dans le traitement du cancer.

16. Combinaison pour utilisation selon les revendications 14 ou 15, dans laquelle le cancer est un cancer du sein.

25 17. Combinaison pour utilisation selon la revendication 16, dans lequel le cancer du sein est un cancer du sein ER positif.

30 18. Composé selon la revendication 1 qui est une forme cristalline du 2-méthoxy-N-{4-méthoxy-6-[(1H-pyrazol-1-yl)méthyl]-1,2-benzoxazol-3-yl}benzène-1-sulfonamide anhydre (Forme 1), présentant un motif de diffraction de

rayons X sur poudres comprenant des pics à des valeurs  $2\theta$  de : 13,4 et 18,1  $^{\circ}2\theta \pm 0,2^{\circ}2\theta$ .

19. Forme cristalline selon la revendication 18, présentant un motif de diffraction de rayons X sur poudres  
5 comprenant en outre au moins un pic choisi parmi les valeurs  $2\theta$  de : 11,4, 14,1 et 17,5  $^{\circ}2\theta \pm 0,2^{\circ}2\theta$ .

20. Forme cristalline selon la revendication 18, présentant un motif de diffraction de rayons X sur poudres  
comprenant en outre des pics aux valeurs  $2\theta$  de : 11,4, 14,1  
10 et 17,5  $^{\circ}2\theta \pm 0,2^{\circ}2\theta$ .