(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

(43) Date de la publication internationale
24 octobre 2002 (24.10.2002)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 02/083656 A3

(51) Classification internationale des brevets[7] :
C07D 277/28, A61K 31/33, A61P 43/00, C07D 277/34, 417/04, 417/06, 233/50, 401/06, 417/14, 233/54

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR02/01218

(22) Date de dépôt international : 9 avril 2002 (09.04.2002)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

01/04943	10 avril 2001 (10.04.2001)	FR
02/01811	14 février 2002 (14.02.2002)	FR

(71) Déposant *(pour tous les États désignés sauf US)* : **SOCIETE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'APPLICATIONS SCIENTIFIQUES (S.C.R.A.S.)** [FR/FR]; Société par Actions Simplifiée, 42, rue du Docteur Blanche, F-75016 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : **HARNETT, Jeremiah** [IE/FR]; 32, allée de la Bergerie, F-91190 Gif-sur-Yvette (FR). **BIGG, Dennis** [FR/FR]; 12, rue des Bénédictines, F-91190 Gif-sur-Yvette (FR). **LIBERATORE, Anne-Marie** [FR/FR]; 10, rue de la Croix Picard, F-78610 Auffargis (FR). **ROLLAND, Alain** [FR/FR]; 10, rue des Piverts, F-91120 Palaiseau (FR).

(74) Mandataire : **BOURGOUIN, André**; Beaufour Ipsen - S.C.R.A.S., Direction de la Propriété Industrielle, 24, rue Erlanger, F-75781 Paris Cedex 16 (FR).

(81) États désignés *(national)* : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés *(régional)* : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :
— *avec rapport de recherche internationale*

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 3 janvier 2003

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) **Title:** 5-MEMBERED HETEROCYCLES, PREPARATION AND USE THEREOF AS MAO INHIBITORS AND LIPID PEROXIDATION INHIBITORS, PREPARATION THEREOF AND USE THEREOF AS MEDICAMENTS

(54) **Titre :** DERIVES D'HETEROCYCLES A 5 CHAINONS ET LEUR UTILISATION EN TANT QU'INHIBITEURS DE LA MAO ET/OU PEROXYDATION LIPIDIQUE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION COMME MEDICAMENTS

(57) **Abstract:** The invention relates to thiazole, oxazole or imidazole derivatives having at least one of the following pharmacological activities: inhibition of monoamine oxidases (MAO); inhibition of lipid peroxidation; modulation of sodium channels. The inventive compounds comprise, for example, 2,6-di*tert*-butyl-4-{2-[2-(methylamino)ethyl]-1,3-thiazol-4-yl}phenol; et le 2-[4-(1,1'-biphenyl-4-yl)-1*H*-imidazol-2-yl]ethylcarbamate de 4-methylpenty l. By virtue of their pharmacological properties, said compounds can be used to treat one of the following disorders or diseases: Parkinson's disease, senile dementia, Alzheimer's disease, Huntington's chorea, amyotrophic lateral sclerosis, schizophrenia, depression, psychoses, migraine or pain, especially neuropathic pain.

(57) **Abrégé :** L'invention concerne des dérivés de thiazoles, d'oxazoles ou d'imidazoles ayant au moins l'une des activités pharmacologiques suivantes: inhibition des monoamine oxydases (MAO); inhibition de la peroxydation lipidique; modulation des canaux sodiques. Ces composés comprenant par exemple: - le 2,6-di*tert*-butyl-4-{2-[2-(méthylamino)éthyl]-1,3-thiazol-4-yl}phénol; et le 2-[4-(1,1'-biphényl-4-yl)-1*H*-imidazol-2-yl]éthylcarbamate de 4-méthylpentyle. Du fait de leurs propriétés pharmacologiques, lesdits composés peuvent notamment être utilisés pour à traiter l'un des désordres ou l'une des maladies suivantes: la maladie de Parkinson, les démences séniles, la maladie d'Alzheimer, la chorée de Huntington, la sclérose latérale amyotrophique, la schizophrénie, les dépressions, les psychoses, la migraine ou les douleurs et en particulier les douleurs neuropathiques.

WO 02/083656 A3