(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
17 novembre 2005 (17.11.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/108398 A1

(51) Classification internationale des brevets[7] :
C07D 471/04, A61K 31/437, 31/407

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2005/000971

(22) Date de dépôt international : 20 avril 2005 (20.04.2005)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0404251 21 avril 2004 (21.04.2004) FR

(71) Déposant *(pour tous les États désignés sauf US)* :
SANOFI-AVENTIS [FR/FR]; 174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

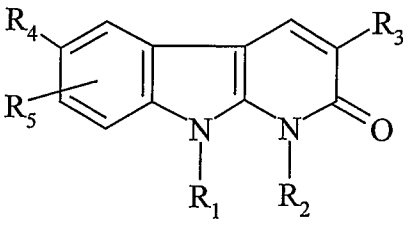
(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : **BOURRIE, Bernard** [FR/FR]; 678, rue de la Colline, F-34980 Saint-Gély-du-Fesc (FR). **CASELLAS, Pierre** [FR/FR]; 10, rue Carl von Linné, F-34090 Montpellier (FR). **CIAPETTI, Paola** [IT/FR]; 12, Route des Romains, F-67120 ALTORF (FR). **DEROCQ, Jean Marie** [FR/FR]; 6, rue des Clauzes, F-34570 Murviel-les-Montpellier (FR). **JEGHAM, Samir** [TN/FR]; 206, rue des Asphodèles, F-34980 Montferrier-sur-Lez (FR). **MUNEAUX, Yvette** [FR/FR]; 266, chemin des Pérayrols, F-34270 Les Matelles (FR). **WERMUTH, Camille-George** [FR/FR]; 3 rue de la Côte d'Azur, F-67100 Strasbourg (FR).

(74) Mandataire : **JACOBI, Markus**; Sanofi-Aventis, 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

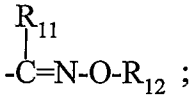
[Suite sur la page suivante]

(54) Title: 6-SUBSTITUTED PYRIDOINDOLONE DERIVATIVES PRODUCTION AND THERAPEUTIC USE THEREOF

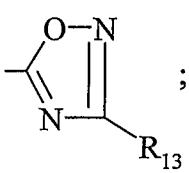
(54) Titre : DERIVES DE PYRIDOINDOLONE SUBSTITUES EN -6, LEUR PREPARATION, LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE.



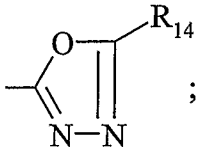
(I)



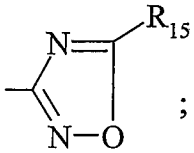
(a)



(b)



(c)



(d)

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I), where R_1 = H, C_1-C_4 alkyl, $-(CH_2)_mOH$, $-(CH_2)_mCN$, or $-(CH_2)_mNR_9R_{10}$, R_2 =H, or C_1-C_4 alkyl, R_3 = phenyl substituted by R_6, R_7, or R_8, R_4 = a group of formula (a), a heterocyclic group selected from formulae (b), (c), or (d) and R_5 = H, or C_1-C_4 alkyl. The invention further relates to a production method and therapeutic application thereof.

(57) Abrégé : La présente invention a pour objet des composés répondant à la formule (I) : dans laquelle, - R_1 représente un atome d'hydrogène ; un groupe (C_1-C_4)alkyle ; un groupe $-(CH_2)_mOH$; un groupe $-(CH_2)_mCN$; un groupe $-(CH_2)_mNR_9R_{10}$ - R_2 représente un atome d'hydrogène ou un groupe (C_1 -C_4)alkyle ; - R_3 représente un phényle substitué par R_6, R_7, R_8 ; - R_4 représente un groupe (Formule (a)); un radical hétérocyclique choisi parmi (Formules (b) (c), (d)) : - R_5 représente un atome d'hydrogène ou un groupe (C_1-C_4)alkyle. Procédé de préparation et application en thérapeutique.

WO 2005/108398 A1

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

(84) États désignés *(sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible)* : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

— *avec rapport de recherche internationale*

— *avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues*

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.