(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
11 mars 2004 (11.03.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/020430 A3

(51) Classification internationale des brevets[7] :
C07D 319/06, 405/12, A61K 31/335, A61P 25/08, C07D 413/06

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/002590

(22) Date de dépôt international : 27 août 2003 (27.08.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/10707 29 août 2002 (29.08.2002) FR

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

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : **ABOUAB-DELLAH, Ahmed** [FR/FR]; 2, rue des Eglantiers, F-94320 Thiais (FR). **BAS, Michèle** [FR/FR]; 3, rue Val des Oliviers, F-34570 Pignan (FR). **DARGAZANLI, Gihad** [FR/FR]; 47, boulevard de la Vanne, F-94230 Cachan (FR). **HOORNAERT, Christian** [BE/FR]; 49, avenue Aristide Briand, F-92160 Antony (FR). **LI, Adrien, Tak** [FR/FR]; 14, rue Pierre Bonnard, F-92260 Fontenay aux Roses (FR). **MEDAISKO, Florence** [FR/FR]; 28, avenue Ronsard, F-94100 Saint Maur des Fosses (FR).

(74) Mandataire : **KUGEL, Dominique**; Sanofi-Synthelabo, 174, avenue de France, F-75013 Paris (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, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

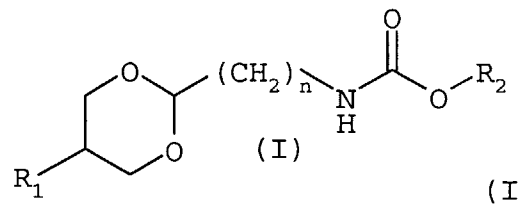
(84) États désignés *(régional)* : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF,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

Publiée :
— *avec rapport de recherche internationale*

[Suite sur la page suivante]

(54) **Title:** DERIVATIVES OF DIOXANE-2-ALKYL CARBAMATES, PREPARATION METHOD THEREOF AND APPLICATION OF SAME IN THERAPEUTICS

(54) **Titre :** DERIVES DE DIOXANE-2-ALKYLCARBAMATES, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to a compound having general formula (I), wherein R_1 denotes a phenyl or naphthalenyl group which is optionally substituted by one or more halogen atoms or groups hydroxy, cyano, nitro, C_{1-3}-alkyl, C_{1-3}-alkoxy, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, benzyloxy, C_{3-6}-cycloalkyl-0- or C_{3-6}-cycloalkylC_{1-3}-alcoxy; R_2 denotes (i) a group having general formula CHR_3CONHR_4, wherein R_3 denotes a hydrogen atom or a methyl group and R_4 denotes a hydrogen atom or group C_{1-3}-alkyl, C_{3-5}-cycloalkyl or (pyridin-4-yl)methyl, (ii) a 2,2,2-trifluoroethyl group, (iii) a (imidazol-2-yl)methyl group, (iv) a (benzimidazol-2-yl)methyl group or (v) a phenyl group which is optionally substituted by one or more halogen atoms or groups cyano, nitro, C_{1-3}-alkyl, C_{1-3}-alkoxy, trifluoromethyl or trifluoromethoxy; and n dentoes a number between 1 and 3, said compound taking the form of a base, an acid addition salt, a hydrate or a solvate. The invention can be used in therapeutics.

(57) **Abrégé :** Composé répondant à la Formule générale (I): dans laquelle R_1 représente un groupe phényle ou naphtalènyle éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène ou groupes hydroxy, cyano, nitro, C_{1-3}-alkyle, C_{1-3}-alcoxy, trifluorométhyle, trifluorométhoxy, benzyloxy, C_{3-6}-cycloalkyl-0- ou C_{3-6}-cycloalkylC_{1-3}-alcoxy; R_2 représente soit un groupe de formule générale CHR_3CONHR_4 dans laquelle R_3 représente un atome d'hydrogène ou un groupe méthyle et R_4 représente un atome d'hydrogène ou un groupe C_{1-3}-alkyle, C_{3-5}-cycloalkyle ou (pyridin-4-yl)méthyle; soit un groupe 2,2,2-trifluoroéthyle; soit un groupe (imidazol-2-yl)méthyle; soit un groupe (benzimidazol-2-yl)méthyle; soit un groupe phényle éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène ou groupes cyano, nitro, C_{1-3}-alkyle, C_{1-3}-alcoxy, trifluorométhyle ou trifluorométhoxy; et n représente un nombre allant de 1 à 3; à l'état de base, de sel d'addition à un acide, d'hydrate ou de solvat. Application en thérapeutique.

WO 2004/020430 A3

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

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 22 avril 2004

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.