

(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  
2 mars 2006 (02.03.2006)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
**WO 2006/021655 A3**

(51) Classification internationale des brevets :  
**C07D 295/108** (2006.01) **A61K 31/445** (2006.01)  
**C07D 451/04** (2006.01) **A61P 15/00** (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2005/001854

(22) Date de dépôt international : 20 juillet 2005 (20.07.2005)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
0408369 29 juillet 2004 (29.07.2004) FR

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

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : **BRAUN, Alain** [FR/FR]; 83, avenue Victor Hugo, F-92100

Boulogne Billancourt (FR). **COURTEMANCHE, Gilles** [FR/FR]; 53 rue Aignan Serres, F-31120 Lacroix Falgarde (FR). **CRESPIN, Olivier** [FR/FR]; 8 Châteaux Bruloir, F-95000 Cergy (FR). **FETT, Eykmar** [DE/FR]; 178, quai Louis Blériot, F-75016 Paris (FR). **PASCAL, Cécile** [FR/FR]; 3, rue Gustave Flaubert, F-92500 Rueil Malmaison (FR).

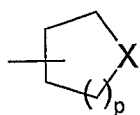
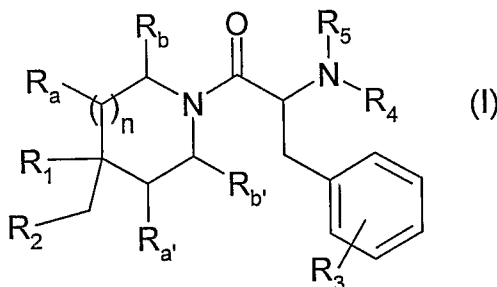
(74) Mandataire : **GUILLAUME, Geneviève**; Sanofi-Aventis, 174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(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, NG, NI, NO, NZ, OM,

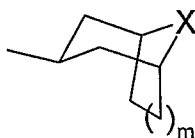
[Suite sur la page suivante]

(54) Title: OXOPIPERIDINE DERIVATIVES, PREPARATION AND THERAPEUTIC USE THEREOF

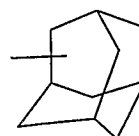
(54) Titre : DÉRIVÉS DOXOPIPERIDINE, LEUR PRÉPARATION ET LEUR APPLICATION EN THÉRAPEUTIQUE



(II)



(III)



(IV)

(57) Abstract: The invention concerns oxopiperidine derivatives of general formula (I) wherein:  $n = 1$ ;  $R_a$ ,  $R_a'$ ,  $R_b$  et  $R_b'$  represent hydrogen atoms or alkyl or cycloalkyl groups, or  $R_b$  and  $R_b'$  together form a carbon bridge;  $R_1$  represents an alkyl or cycloalkyl group;  $R_2$  represents a heteroaryl group;  $R_3$  represents 1 to 3 groups selected among halogen atoms and alkyl, cycloalkyl, -OR, -NRR', -CO-NRR', -NR-CO-R', -NR-CO-NRR', -NR-COOR', -NO<sub>2</sub>, -CN and COOR groups;  $R_5$  represents a hydrogen atom or an alkyl group;  $R_4$  is selected among the groups of formulae (a), (b) and (c), wherein  $p = 0, 1, 2$  or  $3$ ,  $m = 0, 1$  or  $2$ , and  $X$  represents a -C(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>)- or -N(R<sub>10</sub>)- member. The invention also concerns a method for preparing said derivatives and their therapeutic use.

(57) Abrégé : L'invention concerne des dérivés d'oxopipéridine de formule générale (I) dans laquelle :  $n$  est égal à 1,  $R_a$ ,  $R_a'$ ,  $R_b$  et  $R_b'$  représentent des atomes d'hydrogène ou des groupes alkyles ou cycloalkyles, ou  $R_b$  et  $R_b'$  forment ensemble un pont carboné,  $R_1$  représente un groupe alkyle ou cycloalkyle,  $R_2$  représente un groupe hétéroaryle,  $R_3$  représente 1 à 3 groupes choisis parmi les atomes d'halogène et les groupes alkyles, cycloalkyles, -OR, -NRR', -CO-NRR', -NR-CO-R', -NR-CO-NRR', -NR-COOR', -NO<sub>2</sub>, -CN et -COOR,  $R_5$  représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle,  $R_4$  est choisi parmi les groupes de formules (a), (b) et (c), dans lesquelles  $p = 0, 1, 2$  ou  $3$ ,  $m = 0, 1$  ou  $2$ , et  $X$  représente un chaînon -C(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>)- ou -N(R<sub>10</sub>)-

[Suite sur la page suivante]



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), eurasién (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, LV, 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

- (88) **Date de publication du rapport de recherche internationale:**

20 avril 2006

*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.*