20 DEC. 2004
20040 75701

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

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

162162

(43) Date de la publication internationale
5 février 2004 (05.02.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/011402 A3

(51) Classification internationale des brevets[7] :
C07D 409/12, A61K 31/417, A61P 25/00, C07D 409/14

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/002336

(22) Date de dépôt international : 24 juillet 2003 (24.07.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/09416 25 juillet 2002 (25.07.2002) 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).

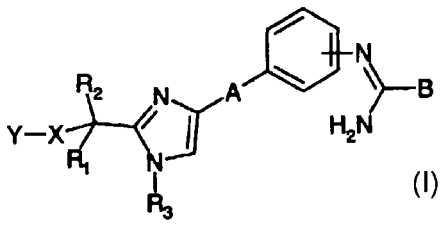
(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : **BIGG, Dennis** [FR/FR]; 12, rue des Benedictines, F-91190 Gif-sur-Yvette (FR). **LIBERATORE, Anne-Marie** [FR/FR]; 10, rue de la Croix Picard, F-78610 Auffargis (FR). **CHABRIER DE LASSAUNIERE, Pierre-Etienne** [FR/FR]; 134, quai Louis Blériot, F-75016 Paris (FR).

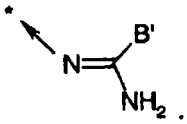
[Suite sur la page suivante]

(54) Title: NOVEL ARYLIMIDAZOLE DERIVATIVES, PREPARATION AND THERAPEUTIC USES THEREOF

(54) Titre : DERIVES D'ARYLIMIDAZOLES ET LEUR UTILISATION EN TANT QU'INHIBITEURS DE NO SYNTHASES ET EN TANT QUE MODULATEURS DES CANAUX SODIQUES



(I)



; (II)

(57) **Abstract:** The invention concerns compounds of general formula (I), wherein R_1 represents H, alkyl, cycloalkyl or cycloalkylalkyl and R_2 represents H or alkyl; R_3 represents H, alkyl or aralkyl; X represents a bond or a linear or branched alkylene radical (II); Y represents H, cycloalkyl, OR_{14}, SR_{15}, NR_4R_5 or A represents a bond or phenyl; B and B' are independently selected among alkyl, NR_6R_7, SR_8 and carbocyclic aryl or heterocyclic aryl radicals with five or six members optionally substituted; R_4 represents H, alkyl, aryl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, aralkyl, $-C(O)R_9$, $-C(O)OR_9$, $-C(O)NHR_9$ or $-SO_2R_9$, or further aryl or aralkyl whereof the aromatic ring is optionally substituted and R_5 represents in particular H or alkyl, or further R_4 and R_5 form with the nitrogen atom bearing them a non-aromatic heterocycle of five to seven members optionally substituted; R_6 represents (in particular) H or alkyl and R_7 represents (in particular) H or alkyl; R_8 represents an alkyl radical optionally substituted; R_9 represents alkyl, haloakyl, cycloalkyl or cycloalkylalkyl, or further one of the aralkyl or aryl or heteroaryl radicals optionally substituted; R_{14} and R_{15} independently represent (in particular) alkyl, phenyl or aralkyl. The compounds of general formula (I) can be used as NO synthase inhibitors and as modulators of sodium channels (for treating pains, multiple sclerosis, the central nervous system or the peripheral nervous system and the like).

(57) **Abrégé :** L'invention concerne les composés de formule générale (I) dans laquelle R_1 représente H, alkyle, cycloalkyle ou cycloalkylalkyle et R_2 représente H ou alkyle; R_3 représente H, alkyle ou aralkyle; X représente une liaison ou un radical alkylène linéaire ou ramifié (II); Y représente H, cycloalkyle, OR_{14}, SR_{15}, NR_4R_5 ou A représente une liaison ou phényle; B et B' sont choisis indépendamment parmi alkyle, NR_6R_7, SR_8 et des radicaux aryle carbocyclique ou aryle hétérocyclique à 5 ou 6 chaînons éventuellement substitués; R_4 représente H, alkyle, aryle, cycloalkyle, cycloalkylalkyle, aralkyle, $-C(O)R_9$, $-C(O)OR_9$, $-C(O)NHR_9$ ou $-SO_2R_9$, ou encore aryle ou aralkyle dont le noyau aromatique est éventuellement substitué et R_5 représente notamment H ou alkyle, ou encore R_4 et R_5 forment avec l'atome d'azote qui les porte un hétérocycle non aromatique de cinq à sept chaînons éventuellement substitué; R_6 représente (notamment) H ou alkyle et R_7 représente (notamment) H ou alkyle; R_8 représente un radical alkyle éventuellement substitué; R_9

[Suite sur la page suivante]

WO 2004/011402 A3