

(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
13 décembre 2001 (13.12.2001)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 01/94325 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :

C07D 277/18, 417/06, 417/12, 277/28, A61K 31/426,
31/427, 31/4439, 31/497, A61P 25/00, C07D 213/38,
213/40, 333/20, 241/12, 213/70, 213/89, C07C 335/06,
215/00, 229/00, 233/00, 271/00, 333/00

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR01/01760

(22) Date de dépôt international : 7 juin 2001 (07.06.2001)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

00/07397 9 juin 2000 (09.06.2000) FR

(71) Déposant : AVENTIS PHARMA S.A. [FR/FR], 20 Avenue Raymond Aron, F-92160 Antony (FR).

(72) Inventeurs: CARRY, Jean-Christophe, 41 rue du Dauphiné, F-94100 Saint Maur des Fossés (FR) DAMOUR, Dominique, 65 bis rue Paul Vaillant Couturier, F-94310 Orly (FR) GUYON, Claude, 17 bis Avenue Henri Martin, F-94100 Saint Maur des Fossés (FR) MIGNANI, Serge, 14 Avenue de Robinson, F-92290 Chatenay-Malabry (FR) BIGOT, Antony, 8 Jean Rostand, F-91300 Massy (FR) BACQUE, Eric, 19 rue Colas, F-91390 Morsang sur Orge (FR) TABART, Michel, 3 rue Paul Langevin, F-91290 La Norville (FR)

(74) Mandataire : ROUSSEAU, Pierrick, Aventis Pharma S.A., Direction Brevets, 20 Avenue Raymond Aron, F-92165 Antony Cedex (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, PL, PT, RO, RU, SD, SI, SG, SL, SK, SJ, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW

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

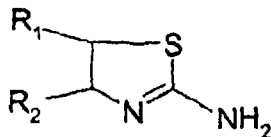
Publiée :

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

(54) Title: 2-AMINOTHIAZOLINE DERIVATIVES AND THEIR USE AS NO-SYNTASE INHIBITORS

(54) Titre : DERIVÉS DE 2-AMINOTHIAZOLINE ET LEUR UTILISATION COMME INHIBITEURS DE NO-SYNTASE



(I)

(57) Abstract: The invention concerns 2-aminothiazoline derivatives of formula (I) wherein either R₁ is a hydrogen atom or an alkyl radical and R₂ is an alkyl, -alk-NH₂, -CH-R₃, -CH₂-S-R₄ or phenyl radical substituted by a nitro or NH-C(=NH)CH₃ radical, or R₁ is an alkyl radical and R₂ is a hydrogen atom, R₃ is a cycloalkyl (3-6C), pyridyl, pyridyl N-oxide, thenyl, thiazolyl, imidazolyl, pyrazinyl, triazolyl, phenyl or phenyl radical substituted by a nitro, hydroxy or carboxy radical, R₄

represents a pyridyl or pyridyl N-oxide radical, alk represents an alkylene radical or their pharmaceutically acceptable salts excluding some known compounds, and the use of said derivatives as inducible NO-synthase inhibitors

(57) Abrégé : La présente invention concerne les dérivés de 2-aminothiazoline de formule (I) dans laquelle soit R₁ est un atome d'hydrogène ou un radical alkyle et R₂ est un radical alkyle, -alk-NH₂, -CH₂-R₃, -CH₂-S-R₄ ou phényle substitué par un radical nitro ou -NH-C(=NH)CH₃, soit R₁ est un radical alkyle et R₂ est un atome d'hydrogène, R₃ est un radical cycloalkyle (3-6C), pyridyle, N-oxyde de pyridyle, thiényl, thiazolyle, imidazolyle, pyrazinyle, triazolyle, phényle ou phényle substitué par un radical nitro, hydroxy ou carboxy, R₄ représente un radical pyridyle ou N-oxyde de pyridyle, alk représente un radical alkylène ou leurs sels pharmaceutiquement acceptables, à l'exclusion de certains composés connus, ainsi que l'utilisation de ces dérivés comme inhibiteurs de NO-synthase inducible

WO 01/94325 A1