

(19) World Intellectual Property Organization

International Bureau

WIPO



162162

(43) International publication date

10 May 2001 (10.05.2001)

PCT

(10) International publication number

WO 01/32638 A1

(51) International patent classification⁷:

A61K 31/425, A61P 3/04, 3/10

C07D 277/60,

(71) Applicant:

AVENTIS PHARMA DEUTSCHLAND GMBH
[DE/DE]; Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt (DE).

(21) International application number:

PCT/EP00/10396

(22) International filing date:

21 October 2000 (21.10.2000)

(25) Language of filing:

German

(26) Language of publication:

German

(30) Data relating to the priority:

199 53 205.2 5 November 1999 (05.11.1999) DE

100 13 306.1 17 March 2000 (17.03.2000) DE

(72) Inventors: JAEHNE, Gerhard; Seebachstrasse 22,
65929 Frankfurt (DE). GOSSEL, Matthias; Im
Lorsbachtal 17a, 65719 Hofheim (DE). LANG, Hans-
Jochen; Rüdesheimer Strasse 7, 65719 Hofheim (DE).
BICKEL, Martin; Mittelstedter Weg 3, 61348 Bad
Homburg (DE).(81) Designated states (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN,
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, 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, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ,
UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

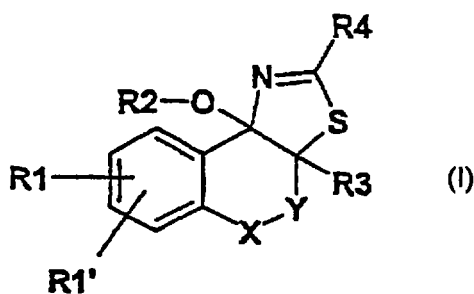
G00002

[continued on next page]

As printed

(54) Title: INDENO-, NAPHTHO-, AND BENZOCYCLOHEPTA-DIHYDROTHIAZOLE DERIVATIVES, THE PRODUCTION THEREOF AND THEIR USE AS ANORECTIC MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: INDENO-, NAPHTHO- UND BENZOCYCLOHEPTA-DIHYDROTHIAZOL DERIVATE, DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG ALS ANOREKTISCHE ARZNEIMITTEL

(57) Abstract: The invention relates to compounds of the formula (I), wherein Y is a direct bond, -CH₂-, -CH₂-CH₂-, X represents CH₂, CH(CH₃), CH(C₂H₅), CH(C₃H₇), CH(C₆H₅); R₄ represents (C₈-C₁₆) cycloalkyl, wherein one or more hydrogen(s) can be substituted in the alkyl groups by fluorine or a hydrogen can be substituted by OH, OC(O)CH₃, OC(O)H, O-CH₂-Ph or O-(C₁-C₄) alkyl; (CH₂)_n-A-R₈, with n = 1-6, with the group -CH₂-O-CH₂-phenyl, wherein phenyl is unsubstituted, being excluded; (CH₂)_r-B-R₉, with r = 1-6; A is O, S, SO, SO₂; B is NH, N-(C₁-C₆) alkyl, NCHO, N(CO-CH₃); R₈ represents (C₅-C₂₄) alkyl, (C₃-C₁₀) cycloalkyl, wherein one or more hydrogen(s) can be substituted in the alkyl groups by fluorine or hydrogen can be substituted by OH, OC(O)CH₃, OC(O)H, O-CH₂-Ph or O-(C₁-C₄) alkyl;(CH₂)_m aryl, with m = 0-6, and aryl is phenyl, naphthyl, biphenyl, thienyl or pyridyl and the aryl part can be substituted up to two times; R₉ represents (CH₂)_m aryl, with m = 0-6, and aryl is phenyl, naphthyl, biphenyl, thienyl or pyridyl and the aryl part can be substituted up to two times, and wherein the groups R₁, R'₁, R₂ and R₃ have the indicated meanings. The invention also relates to the physiologically acceptable salts thereof and to methods for producing them. The inventive compounds are suitable, for example, for use as anorectic agents.(57) Zusammenfassung: Es werden Verbindungen der Formel (I), worin bedeutet Y eine direkte Bindung, -CH₂-, -CH₂-CH₂-, X CH₂, CH(CH₃), CH(C₂H₅), CH(C₃H₇), CH(C₆H₅); R₄ (C₈-C₁₆)-Cycloalkyl, wobei in den Alkylresten ein oder mehrere Wasserstoff(e) durch Fluor ersetzt sein können oder ein Wasserstoff durch OH, OC(O)CH₃, OC(O)H, O-CH₂-Ph oder O-(C₁-C₄)-Alkyl ersetzt sein kann; (CH₂)_n-A-R₈, wobei n = 1-6 sein kann, wobei die Gruppe -CH₂-O-CH₂-Phenyl, worin Phenyl unsubstituiert ist, ausgenommen ist; (CH₂)_r-B-R₉, wobei r = 1-6 sein kann; A O, S, SO, SO₂; B NH, N-(C₁-C₆)-Alkyl, NCHO, N(CO-CH₃); R₈ (C₅-C₂₄)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, wobei in den Alkylresten ein oder mehrere Wasserstoff(e) durch Fluor ersetzt sein können oder ein Wasserstoff durch OH, OC(O)CH₃, OC(O)H, O-CH₂-Ph oder O-(C₁-C₄)-Alkyl ersetzt sein kann; (CH₂)_m-Aryl, wobei m=0-6 und Aryl gleich Phenyl, Naphthyl, Biphenyl, Thienyl oder Pyridyl sein kann und der Arylteil bis zu zweifach substituiert sein kann; R₉ (CH₂)_m-Aryl, wobei m=0-6 und Aryl gleich Phenyl, Naphthyl, Biphenyl, Thienyl oder Pyridyl sein kann und der Arylteil bis zu zweifach substituiert sein kann und worin die Reste R₁, R'₁, R₂ und R₃ die angegebenen Bedeutungen haben, sowie deren physiologisch verträglichen Salze und Verfahren zu deren Herstellung beschrieben. Die Verbindungen eignen sich z.B. als Anorektika.

(84) **Designated states (regional):** ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

- *With the International Search Report.*

For an explanation of the two-letter codes and the other abbreviations, reference is made to the explanations ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") at the beginning of each regular edition of the PCT Gazette.