

(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
13 juillet 2006 (13.07.2006)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2006/072736 A1

(51) Classification internationale des brevets :

C07D 209/42 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01) A61K 31/33 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) A61P 29/00 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2006/000008

(22) Date de dépôt international : 4 janvier 2006 (04.01.2006)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

0550068 7 janvier 2005 (07.01.2005) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) :

SANOFI-AVENTIS [FR/FR]; 174, avenue de France,
F-75013 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : DUBOIS,
Laurent [FR/FR]; 132, avenue de la Résistance, F-92350
Le Plessis-Robinson (FR). EVANNO, Yannick [FR/FR];
5, domaine des Aulnes, F-78830 Bullion (FR). MA-
LANDA, André [FR/FR]; 13, hameau des Coudrayes,
F-91140 Villejust (FR).

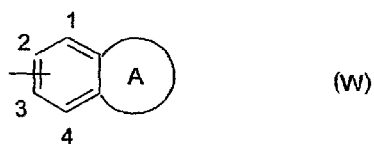
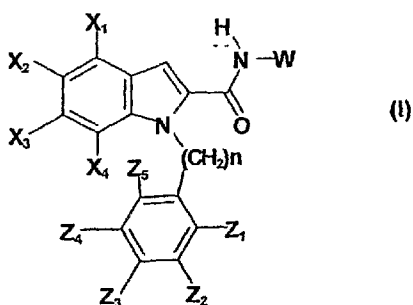
(74) Mandataire : MONAIN, Patrice; Sanofi-Aventis, 174,
avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(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, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY,
MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: N- (HETEROARYL) -1H-INDOLE-2-CARBOXYAMIDE DERIVATIVES AND THEIR USE AS VANILLOID TRPV1 RECEPTOR LIGANDS

(54) Titre : DERIVES DE N- (HETEROARYL) -1H-INDOLE-2-CARBOXYAMIDES ET LEUR UTILISATION COMME LIGANDS DU RECEPTEUR VANILLOIDE TRPV1



(57) Abstract: The invention concerns compounds of general formula (I), wherein: n is equal to 0, 1, 2 or 3; X₁, X₂, X₃, X₄, Z₁, Z₂, Z₃, Z₄ and Z₅ represent a hydrogen atom or certain specific substituents; W represents a fused bicyclic group of formula (a), bound to the nitrogen atom by positions 1, 2, 3 or 4; A represents a 5 to 7-membered optionally substituted heterocycle comprising one to three heteroatoms selected among O, S or N. Said compounds are ligands of the TRPV₁ vanilloid receptor useful for treating pain and inflammation.

(57) Abrégé : L'invention concerne des composés de formule générale (I): dans laquelle n est égal à 0, 1, 2 ou 3; X₁, X₂, X₃, X₄, Z₁, Z₂, Z₃, Z₄ et Z₅ représentent un atome d'hydrogène ou certains substituents spécifiques; W représente un groupe bicyclique fusionné de formule: lié à l'atome d'azote par les positions 1, 2, 3 ou 4; A représente un hétérocycle éventuellement substitué de 5 à 7 chaînons comprenant de un à trois hétéroatomes choisis parmi O, S ou N. Ces composés sont des ligands du récepteur vanilloide TRPV₁ utiles notamment pour le traitement de la douleur et de l'inflammation.

WO 2006/072736 A1



NZ, OM, 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

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.