(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
9 juin 2011 (09.06.2011)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2011/067544 A1

(51) Classification internationale des brevets :
C07D 471/04 (2006.01) *A61P 25/18* (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01) *A61P 25/08* (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01) *A61P 19/10* (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2010/052605

(22) Date de dépôt international :
3 décembre 2010 (03.12.2010)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0958651 4 décembre 2009 (04.12.2009) 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)* : **AUGER, Florian** [FR/FR]; c/o Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR). **EVEN, Luc** [FR/FR]; c/o Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(74) Mandataire : **QUELLARI, Mylène**; c/o Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

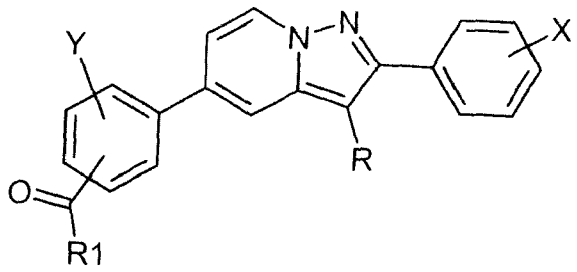
(81) États désignés *(sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible)* : AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés *(sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible)* : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title : DIPHENYL-PYRAZOLOPYRDINE DERIVATIVES, PREPARATION THEREOF, AND USE THEREOF AS NUCLEAR RECEPTOR NOT MODULATORS

(54) Titre : DERIVES DE DIPHENYL - PYRAZOLOPYRDINES, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN TANT QUE MODULATEURS DU RECEPTEUR NUCLEAIRE NOT



(I)

(57) Abstract : The invention relates to formula (I), in which R is a hydrogen or halogen atom or a (C1-C6) alkyl group; X is one or more substituents selected from a hydrogen or halogen atom, a (C1-C6)alkyl, halo(C1-C6)alkyl, (C1-C6)alkoxy, halo(C1-C6)alkoxy, cyano, hydroxy, or hydroxy(C1-C6)alkyl group; Y is a hydrogen or halogen atom or a (C1-C6)alkyl group; R1 is an NR2R3 or OR4 group; R2 and R3 independently are a hydrogen atom, a (C1-C6)alkyl, hydroxy(C1-C6)alkyl or oxo(C1-C6)alkyl group, or R2 and R3, together with the nitrogen atom supporting the same, form a heterocycle optionally substituted by a (C1-C6)alkyl, hydroxy, or oxo group; and R4 is a (C1-C6)alkyl, hydroxy(C1-C6)alkyl, or oxo(C1-C6)alkyl group, in the base or acid addition salt state. Said formula can be used therapeutically for treating or preventing diseases linked to the nuclear receptors Nurr-1, also known as NR4A2, NOT, TINUR, RNR-1, and HZF3.

(57) Abrégé :

[Suite sur la page suivante]

WO 2011/067544 A1

SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Déclarations en vertu de la règle 4.17 :

— *relative à la qualité d'inventeur (règle 4.17.iv))*

Publiée :

— *avec rapport de recherche internationale (Art. 21(3))*

Formule (I) dans laquelle: R représente un atome d'hydrogène ou d'halogène ou un groupe (C1-C6) alkyle; X représente un ou plusieurs substituants choisis parmi un atome d'hydrogène ou d'halogène, un groupe (C1 - C6) alkyle, halogéno (C1 - C6) alkyle, (C1-C6) alcoxy, halogéno (C1 -C6) alcoxy, cyano, hydroxy ou hydroxy (C1-C6) alkyle; Y représente un atome d'hydrogène, d'halogène ou un groupe (C1 -C6) alkyle; R1 représente un groupe NR2R3 ou 0R4; R2 et R3 représentent, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène, un groupe (C1 - C6) alkyle, hydroxy (C1-C6) alkyle ou oxo (C1 -C6) alkyle, ou bien R2 et R3 forment avec l'atome d'azote qui les porte un hétérocycle éventuellement substitué par un groupe (C1 -C6) alkyle, hydroxy ou oxo, R4 représente un groupe (C1 -C6) alkyle, hydroxy (C1 - C6) alkyle ou oxo (C1 -C6) alkyle, à l'état de base ou de sel d'addition à un acide. Utilisation en thérapeutique dans le traitement ou la prévention de maladies impliquant les récepteurs nucléaires Nurr-1, aussi appelés NR4A2, NOT, TINUR, RNR-1, et HZF3.