

10 JAN 2002

2002060123

(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
1 février 2001 (01.02.2001)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 01/07424 A1(51) Classification internationale des brevets⁷:
C07D 277/42, 277/56, 417/00, A61K 31/426, A61P 5/02Christophe [FR/FR]; 148, rue d'Aulnay, F-92290 Chate-
nay Malabry (FR). SACKUR, Carole [FR/FR]; 16, rue
Michel le Comte, F-75003 Paris (FR). THURIEAU,
Christophe [FR/FR]; 84, avenue Kléber, F-75016 Paris
(FR).(21) Numéro de la demande internationale:
PCT/FR00/02095

(22) Date de dépôt international: 21 juillet 2000 (21.07.2000)

(74) Mandataire: BOURGOUIN, André; Beaufour Ipsen -
S.C.R.A.S., Direction de la Propriété Industrielle, 42, rue
du Docteur Blanche, F-75016 Paris (FR).

(25) Langue de dépôt: français

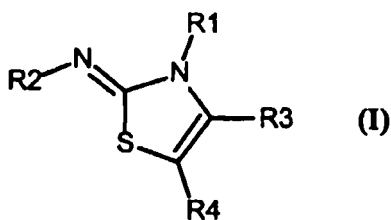
(26) Langue de publication: français

(81) États désignés (*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, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.(30) Données relatives à la priorité:
99/09496 22 juillet 1999 (22.07.1999) FR(71) Déposant (*pour tous les États désignés sauf US*): SOCI-
ETE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'AP-
PLICATIONS SCIENTIFIQUES (S.C.R.A.S.) [FR/FR];
51/53, rue du Docteur Blanche, F-75016 Paris (FR).(84) États désignés (*régional*): brevet ARIPO (GH, GM, KE,
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), brevet eurasi-
en (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU,

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (*pour US seulement*): MOINET,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: 2-ARYLIMINO-2,3-DIHYDROTHIAZOLES, AND THEIR USE THEREOF AS SOMATOSTATIN RECEPTOR LIG-
ANDS(54) Titre: 2-ARYLIMINO-2,3-DIHYDROTHIAZOLES ET LEUR UTILISATION COMME LIGANDS DES RECEPTEURS DE
LA SOMATOSTATINE(57) Abstract: The invention concerns novel 2-arylimino-2,3-dihydrothiazole
derivatives of general formula (I), their preparation methods and their use as
medicines, in particular for treating pathological conditions or diseases wherein
one (or several) somatostatin receptors is/are involved. Said pathological condi-
tions include in particular acromegaly, pituitary adenoma or endocrine gastroen-
teropancreatic tumours including the carcinoid syndrome, and gastrointestinal
bleeding. In general formula (I), R1 represents in particular an alkyl, aralkyl,
cyclohexyl radical optionally substituted by an amino radical or R1 represents
a -C(R11)(R12)-CO-R10 radical wherein R11 represents H, R12 represents in
particular H, carbocyclic or heterocyclic alkyl, cycloalkyl or aralkyl and R10represents in particular an aminoalkylamino radical; R2 represents a carbocyclic or heterocyclic aryl radical optionally substituted; R3
represents in particular COR5 or a carbocyclic or heterocyclic alkyl, adamantyl, aryl radical optionally substituted, carbocyclic or
heterocyclic aralkyl optionally substituted on the aryl group; and R5 represents a radical fixed by a nitrogen atom to the group CO.(57) Abrégé: L'invention a pour objet de nouveaux dérivés de 2-arylimino-2,3-dihydrothiazoles de formule générale (I), leurs pro-
cédés de préparation et leur utilisation en tant que médicaments, en particulier dans le traitement des états pathologiques ou des
maladies dans lesquels un (ou plusieurs) des récepteurs de la somatostatine est (sont) impliqué(s). Ces états incluent en particulier
l'acromégalie, les adénomes hypophysaires ou les tumeurs gastroentéropancréatiques endocriniennes dont le syndrome carcinoïde,
et les saignements gastro-intestinaux. R1 représente notamment un radical alkyle, aralkyle ou cyclohexyle éventuellement substitué
par un radical amino ou R1 représente un radical -C(R11)(R12)-CO-R10 dans lequel R11 représente H, R12 représente notamment
H, alkyle, cycloalkyle ou aralkyle carbocyclique ou hétérocyclique et R10 représente notamment un radical aminoalkylamino; R2
représente un radical aryle carbocyclique ou hétérocyclique éventuellement substitué; R3 représente notamment COR5 ou un radi-
cal alkyle, adamantyle, aryle carbocyclique ou hétérocyclique éventuellement substitué, aralkyle carbocyclique ou hétérocyclique
éventuellement substitué sur le groupe aryle; et R5 représente un radical fixé par un atome d'azote au groupe CO.

WO 01/07424 A1



ACTION