(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
29 septembre 2005 (29.09.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/090322 A1

(51) Classification internationale des brevets[7] :
C07D 295/185, A61K 31/496, C07D 261/08, 209/16, A61K 31/495, C07D 231/12, 239/26, A61K 31/506, C07D 277/28, A61P 29/00, 25/00, 35/00, 37/00, 31/00, 33/00

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2005/000450

(22) Date de dépôt international :
25 février 2005 (25.02.2005)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0401953 26 février 2004 (26.02.2004) 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)* : **ABOUAB-DELLAH, Ahmed** [FR/FR]; 2, rue des Eglantiers, F-94320 Thiais (FR). **ALMARIO GARCIA, Antonio** [ES/FR]; 26, avenue Roger Salengro, F-92290 Chatenay Malabry (FR). **HOORNAERT, Christian** [BE/FR]; 49, avenue Aristide Briand, F-92160 Antony (FR). **LI, Adrien, Tak** [FR/FR]; 14, rue Pierre Bonnard, F-92260 Fontenay aux Roses (FR).

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

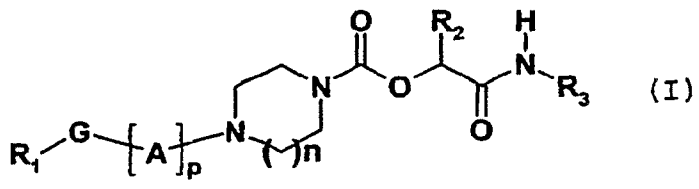
(81) États désignés *(sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible)* : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, 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), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,

[Suite sur la page suivante]

(54) **Title:** DERIVATIVES OF ALKYLPIPERAZINE- AND ALKYLHOMOPIPERAZINE- CARBOXYLATES, PREPARATION METHOD THEREOF AND USE OF SAME AS FAAH ENZYME INHIBITORS

(54) **Titre :** DERIVES DE ALKYLPIPERAZINE- ET ALKYLHOMOPIPERAZINE- CARBOXYLATES, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN TANT QU'INHIBITEURS DE L'ENZYME FAAH



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to a compound having general formula (I), wherein: n = 1 or 2; p represents an integer varying between 1 and 7; A is selected from one or more X, Y and/or Z groups; X = optionally-substituted methylene; Y = C_2-alkenylene, optionally substituted, or C_2-alkynylene; Z = C_{3-7}-cycloalkyl; G = single bond, O, S, SO, SO_2, C=O or CH(OH); R_1 represents an aryl- or heteroaryl-type group; and R_2 represents a hydrogen atom or a C_{1-6}-alkyl group; R_3 represents a hydrogen atom or a C_{1-6}-alkyl, C_{3-7}-cycloalkyl, C_{3-7}-cycloalkyl-C_{1-3}-alkyl group, said compound taking the form of a base, an acid addition salt, a hydrate or a solvate. The invention also relates to the use thereof as FAAH enzyme inhibitors for the treatment of pain, inflammation, neurodegenerative diseases, etc.

(57) **Abrégé :** Composé répondant à la formule générale (I): dans laquelle n = 1 ou 2 ; p représente un nombre entier allant de 1 à 7 ; A est choisi parmi un ou plusieurs groupes X, Y et/ou Z ; X = méthylène éventuellement substitué ; Y = C_2-alcènylène éventuellement substitué ou C_2-alcynylène ; Z = C_{3-7}-cycloalkyle ; G = liaison simple, O, S, SO, SO_2, C=O ou CH(OH) ; R_1 représente un groupe de type aryle ou hétéroaryle; R_2 représente un atome d'hydrogène ou un groupe C_{1-6}-alkyle ; R_3 représente un atome d'hydrogène ou un groupe C_{1-6}-alkyle, C_{3-7}-cycloalkyle, C_{3-7}-cycloalkyl-C_{1-3}-alkyle ; à l'état de base, de sel d'addition à un acide, d'hydrate ou de solvat, leur utilisation en tant qu'inhibiteurs de l'enzyme FAAH pour le traitement de la douleur, de l'inflammation, des maladies neurodégénératives etc.

WO 2005/090322 A1

FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, 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.