

(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
28 août 2003 (28.08.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 03/070690 A2

(51) Classification internationale des brevets⁷ :

C07C 257/18, A61K 31/196,

A61P 7/04, C07C 311/13, 311/19, C07D 213/34, C07C
259/18, C07D 295/22, 261/20, C07K 5/06

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR03/00506

(22) Date de dépôt international :

17 février 2003 (17.02.2003)

(25) Langue de dépôt :

français

(26) Langue de publication :

français

(30) Données relatives à la priorité :

02/02199 21 février 2002 (21.02.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : **LES
LABORATOIRES SERVIER** [FR/FR]; 12, place de la
Défense, F-92415 Courbevoie Cedex (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : **DE
NANTEUIL, Guillaume** [FR/FR]; 12, rue du Chemin
Vert, F-92150 Suresnes (FR). **GLOANEC, Philippe**
[FR/FR]; 18, avenue de l'Abreuvoir, F-78160 Marly le
Roi (FR). **VERBEUREN, Tony** [BE/FR]; 60 bis, rue
Aristide-Briand, F-78540 Vernouillet (FR). **RUPIN, Alain**
[FR/FR]; La Saintrie, F-37510 Savonnières (FR).

(74) Mandataire : **LES LABORATOIRES SERVIER**; 12,
place de la Défense, F-92415 Courbevoie Cedex (FR).

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,
DE, DK, DM, DZ, EC, 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, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC,
VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet
eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR),
brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

— sans rapport de recherche internationale, sera republiée
dès réception de ce rapport

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrévia-
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de
la Gazette du PCT.

(54) Title: NOVEL AMINO ACID DERIVATIVES, METHOD FOR PRODUCTION THEREOF AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING SAID DERIVATIVE

(54) Titre : NOUVEAUX DERIVES D'ACIDES AMINES, LEUR PROCEDE DE PREPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I): where R₁ = an aryl, heteroaryl or alkyl group, optionally substituted with a group of formula -(CO)-CR₆R₇NR₈R₉, where R₆, R₇, R₈ and R₉ are as defined in the description, R₂ = H or optionally substituted alkyl, R₃ = H or optionally substituted alkyl, R₄ = H or optionally substituted alkyl, or R₃ and R₄ form, together with the carbon of attachment, an optionally substituted, 3- to 18-membered, saturated or unsaturated mono-, bi- or tri-cyclic system, optionally comprising one or several heteroatoms selected from O, S and N, n = 0, 1 or 2, Ar = aryl or heteroaryl group and R₅ = optionally substituted amino, guanidino, cyano or amidino, the optical isomers and addition salts thereof with a pharmacologically acceptable acid. The above are of application as medicaments.

(57) Abrégé : Composé de formule (I) : dans laquelle : R₁ représente un groupement aryle, hétéroaryle, alkyle éventuellement substitué, ou un groupement de formule -(CO)-CR₆R₇NR₈R₉ dans lequel R₆, R₇, R₈ et R₉ sont tels que définis dans la description, R₂ représente un atome d'hydrogène ou un groupement alkyle, R₃ représente un atome d'hydrogène ou un groupement alkyle éventuellement substitué, R₄ représente un atome d'hydrogène ou un groupement alkyle éventuellement substitué, ou bien R₃ et R₄ forment ensemble, avec l'atome de carbone qui les porte, un système mono-, bi- ou tricyclique, saturé ou insaturé, de 3 à 18 chaînons, comportant éventuellement un ou plusieurs hétéroatomes choisis parmi O, S et N, et éventuellement substitué, n représente zéro, 1 ou 2, Ar représente un groupement aryle ou hétéroaryle, R₅ représente un groupement amino, guanidino, cyano ou amidino éventuellement substitué, ses isomères optiques ainsi que ses sels d'addition à un acide pharmaceutiquement acceptable.



WO 03/070690 A2