

13 APR 2006
2006025332

(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
28 avril 2005 (28.04.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/037783 A3

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07D 471/08, A61K 31/4748, A61P 25/00

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2004/002643

(22) Date de dépôt international :
15 octobre 2004 (15.10.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0312165 17 octobre 2003 (17.10.2003) 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) :
DARGAZANLI, Gihad [FR/FR]; 47, boulevard de

la Vanne, F-94230 Cachan (FR). ESTENNE-BOUHTOU,
Geneviève [FR/FR]; 18, rue des Jardins, F-94550
Chevilly-Larue (FR). MAGAT, Pascale [FR/FR];
34, avenue Mazarin, F-91380 Chilly-Mazarin (FR).
MARABOUT, Benoît [FR/FR]; 45 bis, rue de Versailles,
F-91300 Massy (FR). ROGER, Pierre [FR/FR]; 6, rue
Paul Valéry, F-78180 Montigny le Bretonneux (FR).

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

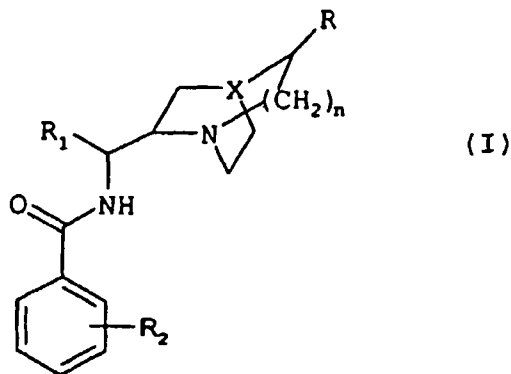
(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, 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, 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,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: USE OF TRICYCLIC COMPOUNDS AS GLYCINE TRANSPORT INHIBITORS

(54) Titre : COMPOSES TRICYCLIQUES COMME INHIBITEURS DE TRANSPORT DE GLYCINE



(57) Abstract: The invention relates to a compound having general formula (I), wherein: R represents a hydrogen atom or a vinyl group; n represents 0, 1 or 2; X represents a groups having formula CH or a nitrogen atom; R₁ represents a phenyl or naphthyl group, or a cyclohexyl group, or a heteroaryl group; R₂ represents a hydrogen atom, or one or more substituents selected from among the halogen atoms and the trifluoromethyl, alkyl, alkoxy, thienyl, phenyloxy, hydroxy, mercapto, thioalkyl, cyano groups or a group having general formula -NR₄R₅, SO₂NR₄R₅, -SO₂-alkyl, -SO₂-phenyl, -CONR₄R₅, -COOR₇, -CO-alkyl, -CO-phenyl, -NHCOR₈, -NHSO₂-alkyl, -NHSO₂-phenyl and -NHSO₂NR₄R₅ or a divalent group having formula -OCF₂O-; and R₄ and R₅ each represent a hydrogen atom or an alkyl group or R₄ and R₅, together with the nitrogen atom bearing same, form a pyrrolidine, piperidine or morpholine

ring. Compounds having formula (I) have a unique activity as specific inhibitors of glyt1 and/or glyt2 transporters.

(57) Abrégé : Composé de formule générale (I) dans laquelle R représente un atome d'hydrogène ou un groupe vinyle ; n représente 0 ou 1 ou 2 ; X représente un groupe de formule CH ou un atome d'azote ; R₁ représente soit un groupe phényle ou naphthyle, soit un groupe cyclohexyle, soit un groupe hétéroaryle ; R₂ représente soit un atome d'hydrogène, soit un ou plusieurs substituants choisis parmi les atomes d'halogène et les groupes trifluorométhyle, alkyle, alcoxy, thiényl, phényloxy, hydroxy, mercapto, thioalkyle, cyano ou un groupe de formule générale -NR₄R₅, SO₂NR₄R₅, -SO₂-alkyle, -SO₂-phényle, -CONR₄R₅, -COOR₇, -CO-alkyle, -CO-phényle, -NHCOR₈, -NHSO₂-alkyle, -NHSO₂-phényle et -NHSO₂NR₄R₅ ou un groupe divalent de formule -OCF₂O- ; R₄ et R₅ représentent chacun un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle ou R₄ et R₅ forment avec l'atome d'azote qui les porte un cycle pyrrolidine, pipéridine ou morpholine. Les composés de formule (I) présentent une activité particulière comme inhibiteurs spécifiques des transporteurs de glyt1 et/ou glyt2.



ACTION

WO 2005/037783 A3