G00002

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau

WIPO

PCT

(43) International publication date
26 April 2001 (26.04.2001)

(10) International publication number
WO 01/29026 A1

(51) International patent classification[7]: C07D 401/06, A61K 31/4709, 31/4725, A61P 9/00, C07D 401/14, 217/02, 215/14

(21) International application number: PCT/FR00/02910

(22) International filing date: 19 October 2000 (19.10.2000)

(25) Language of filing: French

(26) Language of publication: French

(30) Data relating to the priority:
99/13,206 22 October 1999 (22.10.1999) FR
00/08,328 28 June 2000 (28.06.2000) FR

(71) Applicant *(for all designated States except US)*: SANOFI-SYNTHELABO [FR/FR]; 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants *(US only)*: BARONI, Marco [IT/IT]; Via Umberto I, 9, I-20010 Vanzago (IT). BOURRIE, Bernard [FR/FR]; 138, rue des Kermes, F-34980 Saint Gély du Fesc (FR). CARDAMONE, Rosanna [IT/IT]; Via al Roccolo, 5C, I-22100 Como (IT). CASELLAS, Pierre [FR/FR]; 10, rue Carl van Linné F-34090 Montpellier (FR). GUZZI, Umberto [IT/IT]; Via don Gnocchi, 28, I-20148 Milan (IT).

(74) Representative: VARADY, Peter; Sanofi-Synthelabo, 174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

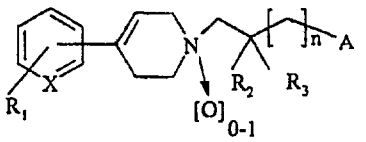
(81) Designated states *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

[continued on next page]

As printed

(54) Title: PHENYL- AND PYRIDYL-TETRAHYDRO-PYRIDINES HAVING TNF INHIBITING ACTIVITY

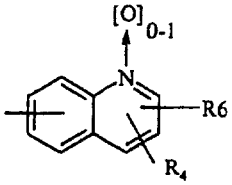
(54) Titre: PHENYL- ET PYRIDYL-TETRAHYDRO-PYRIDINES POSSEDANT UNE ACTIVITE INHIBITRICE DE FNT



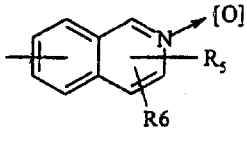
(I)



162162



(a)



(b)

(57) Abstract: The invention concerns compounds of formula (I) wherein: X represents N or CH; R_1 represents a hydrogen or halogen atom, or a CF_3 group; R_2 and R_3 independently represent a hydrogen atom or a methyl group; n is 0 or 1; A represents a group of formula (a) or (b) wherein: R_4 represents a hydrogen or halogen atom, a C_1-C_4 alkyl group, a CF_3 group, an amino, mono(C_1-C_4)alkylamino, di(C_1-C_4)alkylamino; R_5 represents a hydrogen or halogen atom, a (C_1-C_4)alkoxy group, a (C_1-C_4)alkyl group or a CF_3 group; R_6 represents a hydrogen atom, a (C_1-C_4)alkyl group or a (C_1-C_4)alkoxy group; and their salts or solvates, pharmaceutical compositions containing them, a method for preparing them and the synthesis intermediates in said method.

(57) Abrégé: La présente invention concerne des composés de formule (I) dans laquelle X représente N ou CH; R_1 représente un atome d'hydrogène ou d'halogène, ou un groupe CF_3; R_2 et R_3 représentent indépendamment un atome d'hydrogène ou un groupe méthyle; n est 0 ou 1; A représente un groupe de formule (a) ou (b) où R_4 représente un atome d'hydrogène ou d'halogène, un groupe (C_1-C_4) alkyle, un groupe CF_3, un groupe amino, mono(C_1-C_4)alkylamino, di(C_1-C_4)alkylamino; R_5 représente un atome d'hydrogène ou d'halogène, un groupe (C_1-C_4)alkyle ou un groupe (C_1-C_4)alkoxy, un groupe (C_1-C_4)alkyle ou un groupe CF_3; R_6 représente un atome d'hydrogène, un groupe (C_1-C_4)alkoxy; ainsi que ses sels ou solvates, les compositions pharmaceutiques les contenant, un procédé pour leur préparation et des intermédiaire de synthèse dans ce procédé.

WO 01/29026 A1

(84) **Designated states** *(regional)*: ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

- *With the International Search Report.*
- *Before expiry of the period provided for amending the claims, will be republished if such amendments are received.*

For an explanation of the two-letter codes and the other abbreviations, reference is made to the explanations ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") at the beginning of each regular edition of the PCT Gazette.