(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

PCT

(43) Date de la publication internationale
2 mars 2006 (02.03.2006)

(10) Numéro de publication internationale
WO 2006/021656 A2

(51) Classification internationale des brevets :
C07D 451/04 (2006.01) *C07D 405/12* (2006.01)
C07D 453/02 (2006.01) *C07D 401/14* (2006.01)
A61K 31/4468 (2006.01) *A61P 15/10* (2006.01)
A61K 31/439 (2006.01) *C07D 211/58* (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2005/001855

(22) Date de dépôt international : 20 juillet 2005 (20.07.2005)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0408370 29 juillet 2004 (29.07.2004) 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)* : **BRAUN, Alain** [FR/FR]; 83, avenue Victor Hugo, F-92100 Boulogne Billancourt (FR). **CORNET, Bruno** [FR/FR]; 41 rue de Saint-Germain, F-77930 PERTHES-EN-GATINAIS (FR). **COURTEMANCHE, Gilles** [FR/FR]; 53 rue Aignan Serres, F-31120 Lacroix-Falgarde (FR). **CRESPIN, Olivier** [FR/FR]; 8 Châteaux Bruloir, F-95000 Cergy (FR). **FETT, Eykmar** [DE/FR]; 178, quai Louis Blériot, F-75016 Paris (FR). **PASCAL, Cécile** [FR/FR]; 3, rue Gustave Flaubert, F-92500 Rueil Malmaison (FR).

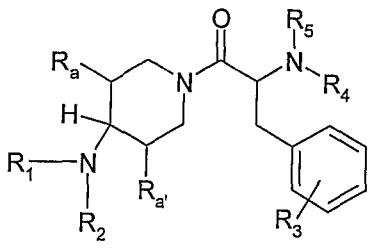
(74) Mandataire : **GUILLAUME, Geneviève**; Sanofi-Aventis, 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(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, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, 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.

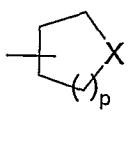
[Suite sur la page suivante]

(54) **Title:** AMINOPIPERIDINE DERIVATIVES, PREPARATION THEREOF AND THERAPEUTIC USE THEREOF

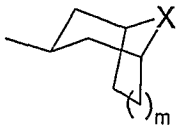
(54) **Titre :** DERIVES D'AMINO-PIPERIDINE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE



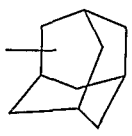
(I)



(a)



(b)



(c)

(57) **Abstract:** The invention concerns aminopiperidine derivatives of general formula (I) wherein: R_a, $R_{a'}$ and R_5 represent hydrogen atoms or alkyl groups; R_1 represent a hydrogen atom and an alkyl, cycloalkyl, heterocycloalkyl or aryl group; R_2 represents a group of formula $-(CH_2)_x-(CO)_y-Y$ or $-(CO)_y-(CH2)_?-Y$, wherein Y represents a hydrogen atom or a hydroxy, alkyl, cycloalkyl, alkoxy, aryl, heteroaryl or $-NR_{11}R_{12}$ group, Y being other than a hydrogen atom when x = y = 0; R_3 represents 1 to 3 groups selected among halogen atoms and alkyl, cycloalkyl, -OR, -NRR', -CO-NRR', -NR-CO-R', -NR-CO-NRR', -NR-COOR', $-NO_2$, -CN and COOR groups; R_4 is selected among groups of formula (a), (b) and (c), wherein p = 0, 1, 2 or 3, m = 0, 1 or 2; X represents an oxygen or suphur atom or a $-C(R_6)(R_7)-$ or $-N(R_{10})-$ member. The invention also concerns a method for preparing said derivatives and their therapeutic use.

(57) **Abrégé :** L'invention concerne des dérivés d'amino-pipéridine de formule générale (I) dans laquelle : R_a, $R_{a'}$- et R_5 représentent des atomes d'hydrogène ou des groupes alkyles, R_1 représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle, cycloalkyle, hétérocycloalkyle ou aryle, R_2 représente un groupe de formule $-(CH_2)_x-(CO)_y-Y$ ou $-(CO)_y-(CH2)_\chi-Y$, dans laquelle Y représente un atome d'hydrogène ou un groupe hydroxy, alkyle, cycloalkyle, alcoxy, aryle, hétéroaryle ou $-NR_{11}R_{12}$, Y étant différent d'un atome d'hydrogène lorsque x = y = 0, R_3 représente 1 à 3 groupes choisis parmi les atomes d'halogène et les groupes alkyles, cycloalkyles, -OR, -NRR', -CO-NRR', -NR-CO-R', -NR-CO-NRR', -NR-COOR', -NO2, -CN et -COOR, R_4 est choisi parmi les groupes de formules (a), (b) et (c), dans lesquelles p = 0, 1 , 2 ou 3, m = 0, 1 ou 2, et X représente un atome d'oxygène ou de soufre ou un chaînon $-C(R_6)(R_7)-$ ou $-N(R_{10})-$: (Formulae (a), (b), (c)). Procédé de préparation et application en thérapeutique.

WO 2006/021656 A2

(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, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, 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 :

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

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.