(41)

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

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

G00002

(43) Date de la publication internationale
23 mai 2002 (23.05.2002)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 02/040474 A3

(51) Classification internationale des brevets[7] :
C07D 409/14, 401/06, 401/14, A61K 31/4709, A61P 31/04, C07D 417/14

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR01/03559

(22) Date de dépôt international :
14 novembre 2001 (14.11.2001)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
00/14738 15 novembre 2000 (15.11.2000) FR

(71) Déposant : **AVENTIS PHARMA S.A.** [FR/FR]; 20 avenue Raymond Aron, F-92160 ANTONY (FR).

(72) Inventeurs: **BACQUÉ, Eric**; 123 allée de la Clairière, F-91190 GIF SUR YVETTE (FR). **CARRY, Jean-Christophe**; 41 rue du Dauphiné, F-94100 SAINT MAUR DES FOSSES (FR). **EL-AHMAD, Youssef**; 11 avenue de Verdun, F-94000 CRETEIL (FR). **EVERS, Michel**; 8 rue Robert Schumann, F-94510 LA QUEUE EN BRIE (FR). **HUBERT, Philippe**; 22 rue Georges Gaume, F-94700 MAISONS-ALFORT (FR). **MALLERON, Jean-Luc**; 2 allée Renoir, F-91460 MARCOUSSIS (FR). **MIGNANI, Serge**; 14 avenue de Robinson, F-92290 CHATENAY-MALABRY (FR). **PANTEL, Guy**; 12 rue Jean-Baptiste Clément, F-94510 LA QUEUE EN BRIE (FR). **TABART, Michel**; 3 rue Paul Langevin, F-91290 LA NORVILLE (FR). **VIVIANI, Fabrice**; 46 rue Jules Fossier, F-95380 LOUVRES (FR).

(74) Mandataire : **LOBJOIS, Françoise**; AVENTIS PHARMA S.A., Direction Brevets, 20 avenue Raymond Aron, F-92165 ANTONY 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, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

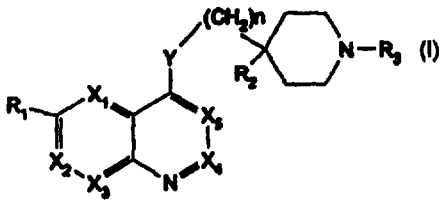
(84) États désignés *(régional)* : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,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

[Suite sur la page suivante]

162162

(54) Title: HETEROCYCLYLALKYL PIPERIDINE DERIVATIVES AND THEIR USE AS ANTIMICROBIAL AGENTS

(54) Titre : DERIVES HETEROCYCLYLALCOYL PIPERIDINE ET LEUR APPLICATION COMME ANTIMICROBIENS



(57) Abstract: The invention concerns heterocyclylalkyl piperidine derivatives of general formula (I), wherein X_1, X_2, X_3, X_4 and X_5 are >C-R'$_1$ to >C-R'$_5$ or one at most represents N; R_2 is COOH, alkyloxycarbonyl, cycloalkyloxycarbonyl, CN, -CONRaRb or R_2 is CH_2OH, alkyl substituted or R_2 is -CF_2-Rc, -C$(CH_3)_2$-Rc, -CO-Rc, -CHOH-Rc, -C(cycloalkyl)-Rc or -CH=CH-Rc; R_3 is phenyl, heterocyclyl. alk-R°$_3$; Y represents >CH-Re or a difluoromethylene, carbonyl, hydroxyiminomethylene, alkyloxyiminomethylene, cycloalkyloxyiminomethylene radical, or a cycloalkylene-1,1 radical; and n = 0 to 4 provided that the radicals or phenyl or heterocyclyl portions mentioned above can optionally be substituted, in the enantiomeric or diastereoisomeric forms or mixtures thereof, and/or as the case may be in their syn or anti form or mixture thereof and their salts.

(57) Abrégé : Dérivés hétérocyclylalcoyl pipéridine de formule générale (I) pour lesquels: X_1, X_2, X_3, X_4 et X_5 sont >C-R'$_1$ à >C-R'$_5$ ou bien l'un au plus représente N, R_2 est COOH, alcoyloxycarbonyle, cycloalcoyloxycarbonyle, CN, -CONRaRb ou R_2 est CH_2OH, alcoyle substitué ou R_2 est -CF_2-Rc, -C$(CH_3)_2$-Rc, -CO-Rc, -CHOH-Rc, -C(cycloalcoyle)-Rc ou -CH=CH-Rc, R_3 est phényle, hétérocyclyle, alk-R°$_3$, Y représente >CH-Re ou un radical difluorométhylène, carbonyle, hydroxyiminométhylène, alcoyloxyiminométhylène, cycloalcoyloxyiminométhylène, ou un radical cycloalcoylène-1,1, et n = 0 à 4 étant entendu que les radicaux ou portions phényle ou hétérocyclyle mentionnés ci-dessus peuvent être éventuellement substitués, sous leurs formes énantiomères ou diastéréoisomères ou les mélanges de ces formes, et/ou le cas échéant sous leur forme syn ou anti ou leur mélange ainsi que leurs sels.

WO 02/040474 A3

Publiée :
— *avec rapport de recherche internationale*

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 31 octobre 2002

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.