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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau

162162

(43) International publication date
10 July 2003 (10.07.2003)

PCT

(10) International publication number
WO 03/055884 A1

(51) International patent classification[7]:
C07D 487/04, A61K 31/50, A61P 25/02, 25/28 // (C07D 487/04, 237:00, 209:00)

(21) International application number: PCT/FR02/03979

(22) International filing date: 20 November 2002 (20.11.2002)

(25) Language of filing: French

(26) Language of publication: French

(30) Data relating to the priority:
01/16,701 21 December 2001 (21.12.2001) 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)*: BURNIER, Philippe [FR/FR]; 8, allée du Bel-Air, F-78600 Maisons-Laffitte (FR). FROISSANT, Jacques [FR/FR]; Cedex 981, La Mulotière, F-41160 Brevainville (FR). MARABOUT, Benoît [FR/FR]; 45bis, rue de Versailles, F-91300 Massy (FR). MARGUET, Frank [FR/FR]; 17, rue Paul Doumer, F-91370 Verrières-Le-Buisson (FR). PUECH, Frédéric [FR/FR]; 1, allée de Savoie, F-78170 La Celle Saint Cloud (FR).

(74) Representative: LUDWIG, Jacques; 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, 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, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

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

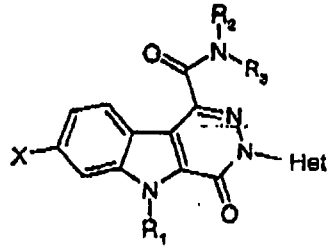
G00002

[continued on next page]

As printed

(54) Title: 3-HETEROARYL-3,5-DIHYDRO-4-OXO-4H-PYRIDAZINO[4,5-B]INDOLE-1-CARBOXAMIDE DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND THERAPEUTIC USE

(54) Titre : DERIVES DE 3-HETEROARYL-3,5-DIHYDRO-4-OXO-4H-PYRIDAZINO[4,5-B]INDOLE-1-CARBOXAMIDE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE



(I)

(57) Abstract: The invention concerns compounds of general formula (I), wherein: X represents a hydrogen or halogen atom; R_1 represents a hydrogen atom or a (C_1-C_4)alkyl group; R_2 and R_3, represent each, independently of each other, a hydrogen atom or a (C_1-C_4)alkyl group, or R_2 and R_3 form, with the atom which bears them, a pyrrolidinyl, piperidinyl, morpholinyl or 4-alkylpiperazinyl group; and Het represents a heteroaromatic group of pyridinyl, 1-oxidopyridinyl, quinolinyl, isoquinolinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridazinyl type, the heteroaromatic group may represent one or several halogen atoms and/or one or several (C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)alkoxyl groups; in the form of bases, addition salts to acids, solvates or hydrates. The invention also concerns pharmaceutical compositions containing same, methods for preparing same and synthesis intermediates.

(57) Abrégé : L'invention a pour objet les composés de formule générale (I) dans laquelle X représente un atome d'hydrogène ou d'halogène ; R_1 représente un atome d'hydrogène ou un groupe (C_1-C_4)alkyle; R_2 et R_3 représentent chacun, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène ou un groupe (C_1-C_4)alkyle, ou bien R_2 et R_3 forment, avec l'atome d'azote qui les porte, un groupe pyrrolidinyle, pipéridinyle, morpholinyle ou 4-alkylpipérazinyle ; et Het représente un groupe hétéroaromatique de type pyridinyle, 1-oxydopyridinyle, quinolinyle, isoquinolinyle, pyrimidinyle, pyrazinyle, pyridazinyle, le groupe hétéroaromatique pouvant porter un ou plusieurs atomes d'halogène et/ou un ou plusieurs groupes (C_1-C_4)alkyle, (C_1-C_4)alcoxyle; à l'état de bases, de sels d'addition à des acides, de solvats ou d'hydrates, les compositions pharmaceutiques les contenant, des procédés pour leur préparation et des intermédiaires de synthèse.

WO 03/055884 A1

Published:
- *With the International Search Report.*

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.