

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

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
9 juin 2005 (09.06.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/051917 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07D 231/20, 453/02,
401/06, 487/08, 453/06, 403/06, 231/14, 231/12, 401/04,
409/04, 403/04, A61K 31/41, 31/435

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2004/002968

(22) Date de dépôt international :
22 novembre 2004 (22.11.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
03 13775 25 novembre 2003 (25.11.2003) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : **AVEN-
TIS PHARMA S.A.** [FR/FR]; 20 Avenue Raymond Aron,
F-92160 ANTONY (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) :
GENEVOIS-BORELLA, Arielle [FR/FR]; 28 Avenue
Hoche, F-94320 THIAIS (FR). **MALLERON, Jean-Luc**
[FR/FR]; 2 Allée Renoir, F-91460 MARCOUSSIS (FR).
BOUQUEREL, Jean [FR/FR]; 40 rue de l'Emancipa-
tion, F-93700 DRANCY (FR). **DOERFLINGER, Gilles**
[FR/FR]; 2 Avenue du Berry, F-91940 LES ULIS (FR).

BOHME, Andrees [DE/FR]; 32 rue Vitruve, F-75020
PARIS (FR). **TOUYER, Gaetan** [FR/FR]; 7 rue du
Vieux Moulin, F-77500 CHELLES (FR). **SABUCO,
Jean-François** [FR/FR]; 198 bis Avenue du Maine,
F-75014 PARIS (FR). **TERRIER, Corinne** [FR/FR]; 98
bis Avenue du Colonel Fabien, F-93190 LIVRY GARGAN
(FR). **MIGNANI, Serge** [FR/FR]; 14 Avenue de Robin-
son, F-92290 CHATENAY-MALABRY (FR). **EVERS,
Michel** [BE/FR]; 8 rue Robert Schuman, F-94510 LA
QUEUE-EN-BRIE (FR). **EL-AHMAD, Youssef** [FR/FR];
11 Avenue de Verdun, F-94000 CRETEIL (FR).

(74) Mandataire : **MOREL-PECHEUX, Muriel**; AVENTIS
PHARMA S.A., Direction Brevets, 20 Avenue Raymond
Aron, F-92165 ANTONY CEDEX (FR).

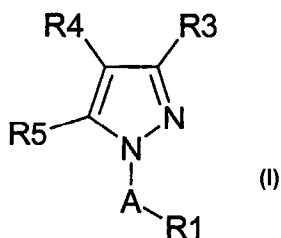
(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,
KP, KR, KZ, LC, LK, LR,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

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: PYRAZOLYL DERIVATIVES IN THE FORM OF DRUGS FOR TREATING ACUTE OR CHRONIC NEURONAL
REGRESSIONS

(54) Titre : DERIVES DE PYRAZOLE A TITRE DE MEDICAMENTS POUR LE TRAITEMENT DES DEGENERESCENCES
NEURONALES AIGUES OU CHRONIQUES



(57) Abstract: The invention relates to novel derivatives of general formula (I), wherein A, if present, is an alkyl radical (C1-C6), an alkenyl radical (C3-C6), an alkynyl radical (C3-C6), a cycloalkyl radical (C3-C7), a cycloalkenyl radical (C5-C7), R1 is a NR₆R₇, azacycloalkyl (C4-C7), azacycloalkenyl (C5-C7) azabicycloalkyl (C5-C9) and azabicycloalkenyl (C5-C9) group; A-R1 is such that nitrogen of R1 et nitrogen 1 of pyrazole are indispensably separated by at lest two carbon atoms, R3 is an H, halogen, OH, SH, NH₂, ORc, SRc, SORa, SO₂Ra, NHCHO, NRaRb, NHC(O)Ra, NHC(S)Ra and NHSO₂Ra radical; R4 is an aryl or heteroaryl radical; R5 is a H, halogen, CF₃, CHF₂, CH₂F, linear or branched alkyl (C1-C6) and cycloalkyl (C3-C7) radical, the racemics, enantiomers and diastereoisomers thereof and the mixtures thereof, tau-tomers thereof and the pharmaceutically acceptable salts thereof.

(57) Abrégé : La présente invention concerne les nouveaux dérivés de formule générale (I) dans laquelle A est, si il est présent, un radical alkyle (C1-C6), un radical alkényle (C3-C6), un radical alkynyle (C3-C6), un radical cycloalkyle (C3-C7), un radical cycloalkényle (C5-C7), R1 est un groupement NR₆R₇, azacycloalkyle (C4-C7), azacycloalkényle (C5-C7) azabicycloalkyle (C5-C9), azabicycloalkényle (C5-C9) ; A-R1 est tel que l'azote de R1 et l'azote 1 du pyrazole sont obligatoirement séparés par au moins deux atomes de carbone, R3 est un radical H, halogène, OH, SH, NH₂, ORc, SRc, SORa, SO₂Ra, NHCHO, NRaRb, NHC(O)Ra, NHC(S)Ra, NHSO₂Ra, R4 est un radical aryle ou hétéroaryle ; R5 est un radical H, halogène, CF₃, CHF₂, CH₂F, alkyle (C1-C6) linéaire ou ramifié, cycloalkyl (C3-C7), leurs racémiques, énantiomères, diastéréoisomères et leurs mélanges, leurs tautomères et leurs sels pharmaceutiquement acceptables.

WO 2005/051917 A1



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, LU, 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 :

— avec rapport de recherche internationale

— avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues

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.