

2004073854

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international

162162

(43) Date de la publication internationale
18 décembre 2003 (18.12.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 03/104225 A1(51) Classification internationale des brevets⁷ :

C07D 417/14, 401/14, A61K 31/497, A61P 25/28

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR03/01685

(22) Date de dépôt international : 5 juin 2003 (05.06.2003)

(25) Langue de dépôt :

français

(26) Langue de publication :

français

(30) Données relatives à la priorité :

02/07001

7 juin 2002 (07.06.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) :

SANOFI-SYNTHELABO [FR/FR]; 174, avenue de
France, F-75013 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

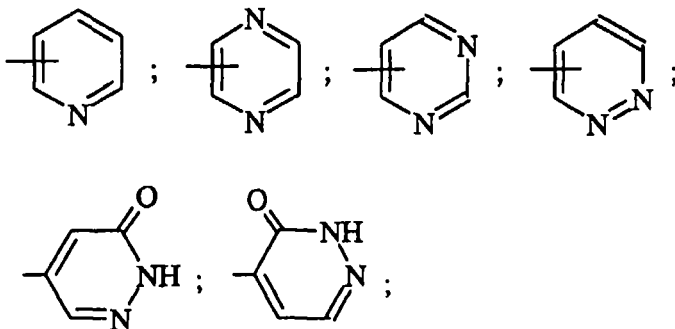
(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : BONO,

Françoise [FR/FR]; 21, rue Philadelphie de Gerde, F-31300
Toulouse (FR). BOSCH, Michaël [FR/FR]; 10, place des
Jurandes, F-34590 Marsillargues (FR). DOS SANTOS,
Victor [FR/FR]; 99, chemin du Bourgidou, F-34130Valergues (FR). HERBERT, Jean, Marc [FR/FR];
10, rue de l'Amandier, F-31170 Tournefeuille (FR).
NISATO, Dino [IT/FR]; 2, rue de Terre Rouge, F-34680
Saint-Georges-d'Orques (FR). TONNERRE, Bernard
[FR/FR]; 96, impasse le Vallon, F-34570 Vailhauques
(FR). WAGNON, Jean [FR/FR]; 90, rue des Galaxies, Le
Hameau de la Rauze, F-34070 Montpellier (FR).(74) Mandataire : THOURET-LEMAITRE, Elisabeth;
Sanofi-Synthelabo, 174, avenue de France, F-75013 Paris
(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, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: PIPERAZINYLACYLPYPERIDINE DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND THERAPEUTIC USE THEREOF

(54) Titre : DERIVES DE PIPERAZINYLACYLPYPERIDINE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE



(57) Abstract: The invention concerns 1-substituted piperazinyllacylpiperidine derivatives of general formula (I), wherein: n is 1 or 2; p is 1 or 2; R₁ represents a halogen atom, a trifluoromethyl radical, C₁-C₄ alkyl, a C₁-C₄ alkoxy, a trifluoromethoxy radical; R₂ represents a hydrogen atom or a halogen atom; R₃ represents a hydrogen atom, an -OR₅ group, a -CH₂OR₅ group, a -NR₆R₇ group, a -NR₈COR₉ group, a -NR₈CONR₁₀R₁₁ group, a -CH₂NR₁₂R₁₃ group, a -CH₂NR₈CONR₁₄R₁₅ group, a C₁-C₄ alkoxycarbonyl; a -CONR₁₆R₁₇ group; or R₃ forms a double bond between the carbon atom whereto it is bound and the neighbouring carbon

atom of the piperidine cycle; R₄ represents an aromatic group selected among (II), said aromatic groups being unsubstituted, monosubstituted or disubstituted by a substituent selected independently among a halogen atom, a C₁-C₄ alkyl, a C₁-C₄ alkoxy, a trifluoromethyl radical. The invention also concerns a method for preparing said compounds and their therapeutic use.

(57) Abrégé : L'invention concerne des dérivés de 1-piperazinyllacylpipéridine substitués, de formule générale (I), dans laquelle: n est 1 ou 2; p est 1 ou 2; R₁ représente un atome d'halogène; un radical trifluorométhyle; un (C₁-C₄)alkyle; un (C₁-C₄)alcoxy; un radical trifluorométhoxy; R₂ représente un atome d'hydrogène ou un atome d'halogène; R₃ représente un atome d'hydrogène; un groupe -OR₅; un groupe -CH₂OR₅; un groupe -NR₆R₇; un groupe -NR₈COR₉; un groupe -NR₈CONR₁₀R₁₁; un groupe -CH₂NR₁₂R₁₃; un groupe -CH₂NR₈CONR₁₄R₁₅; un (C₁-C₄)alkoxycarbonyl; un groupe -CONR₁₆R₁₇; ou bien R₃ constitue une double liaison entre l'atome de carbone auquel il est lié et l'atome de carbone voisin du cycle pipéridine; R₄ représente un groupe aromatique choisi parmi (II); lesdits groupes aromatiques étant non substitués, mono- ou disubstitués par un substituant choisi indépendamment parmi un atome d'halogène; un (C₁-C₄)alkyle; un (C₁-C₄)alcoxy; un radical trifluorométhyle. Procédé de préparation et application en thérapeutique.

WO 03/104225 A1



ACTION