

(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
15 décembre 2005 (15.12.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/118547 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :

C07D 217/02, 217/04,

217/06, 401/12, 405/06, 409/06, A61K 31/4725, 31/472,
31/496, 31/5377, A61P 3/04, 3/10, 25/00

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2005/001279

(22) Date de dépôt international : 24 mai 2005 (24.05.2005)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

0405607 25 mai 2004 (25.05.2004) 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) : **DIAZ
MARTIN, Juan Antonio** [ES/ES]; C/Colombia, 30-5º
izda, E-28016 Madrid (ES). **JIMENEZ BARGUENO,
Maria Dolores** [ES/ES]; Paseo de la Chopera n° 102,
E-28100 Alcobendas (ES).

(74) Mandataire : **GUILLAUME, Geneviève**; Sanofi-Aven-
tis, 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.

(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, 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 re-
çues

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de
la Gazette du PCT.

(54) Title: TETRAHYDROISOQUINOLINE SULFONAMIDE DERIVATIVES, THE PREPARATION THEREOF, AND THE
USE OF THE SAME IN THERAPEUTICS

(54) Titre : DERIVES DE TETRAHYDROISOQUINOLINESULFONAMIDES, LEUR PREPARATION ET LEUR UTILISATION
EN THERAPEUTIQUE

(57) Abstract: The invention relates to a compound of formula (I) wherein n can represent a value between 1 and 6; -(C)n- represents
a C₁₋₆ alkylidene group, optionally substituted by between 1 and 4 substituents; R₁ represents a hydrogen atom, or a C₁₋₆ alkyl group;
R₂ represents a hydrogen atom, a C₁₋₆ alkyl or C₃₋₆ cycloalkyl group optionally substituted by between 1 and 4 substituents; and
B represents NR₃R₄, R₃ and R₄ independently representing a C₁₋₆ alkyl group or a hydrogen atom, or together representing a C₁₋₆
alkylidene group, a C₂₋₈ alkenylidene group, a C₁₋₃ alkylidene-O-C₁₋₃ alkylidene group, or a C₁₋₃ alkylidene-N(R₅)-C₁₋₃ alkylidene
group wherein R₅ represents a hydrogen atom, or a C₁₋₃ alkyl or C₁₋₆ alkylcarbonyl group, said C₁₋₃ alkyl and C₁₋₆ alkylcarbonyl
groups being substitutable, or an aminocycle which is linked by a carbon to the group -NR₁-(C)n-, such as aziridine, azetidine,
pyrrolidine, piperidine or morpholine, the groups R₃, R₄, the aminocycle, and the nitrogen atom being optionally substituted. The
invention can be applied to therapeutics.

(57) Abrégé : Composé répondant à la formule (I): dans laquelle: n peut prendre une valeur de 1 à 6 ; -(C)n- représente un groupe
-C₁₋₆ alkylidène, éventuellement substitué par 1 à 4 substituants; R₁ représente un atome d'hydrogène, un groupe C₁₋₆ alkyle, R₂
représente un atome d'hydrogène, un groupe C₁₋₆ alkyle ou C₃₋₆ cycloalkyle éventuellement substitués par 1 à 4 substituants; B
représente NR₃R₄, R₃ et R₄ représentant, indépendamment l'un de l'autre, un groupe C₁₋₆, alkyle, un atome d'hydrogène; ou R₃ et
R₄ représentent ensemble un groupe C₁₋₆ alkylidène, un groupe C₂₋₈ alkenylidène, un groupe C₁₋₃ alkylidène-O-C₁₋₃ alkylidène, ou un
groupe C₁₋₃ alkylidène-N(R₅)-C₁₋₃ alkylidène où R₅ représente un atome d'hydrogène, un groupe C₁₋₃ alkyle ou C₁₋₆ alkylcarbonyle,
ces groupes C₁₋₃ alkyle et C₁₋₆ alkylcarbonyle pouvant être substitués; ou un aminocycle, lié par un carbone au groupe -NR₁-(C)n-,
tel qu'aziridine, azétidine, pyrrolidine, pipéridine ou morpholine ; les groupes R₃, R₄, ainsi que l'aminocycle étant éventuellement
substitués et l'atome d'azote éventuellement substitué. Application en thérapeutique.

WO 2005/118547 A1