(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
18 janvier 2007 (18.01.2007)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2007/006926 A3

(51) Classification internationale des brevets :
C07D 401/12 (2006.01) *A61K 31/506* (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) *A61K 31/351* (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01) *A61K 31/381* (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2006/001619

(22) Date de dépôt international : 6 juillet 2006 (06.07.2006)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0507370 11 juillet 2005 (11.07.2005) FR
0511950 25 novembre 2005 (25.11.2005) 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)* : **WAGNON, Jean** [FR/FR]; 90 rue des Galaxies, Le Hameau de la Rauze, F-34070 Montpellier (FR). **NGUEFACK, Jean-Flaubert** [FR/FR]; 22 Rue des Muscadels, F-34970 Lattes (FR). **JEGHAM, Samir** [TN/FR]; 206 rue des Asphodèles, F-34980 Montferrier-sur-Lez (FR). **BOSCH, Michaël** [FR/FR]; 10 place des Jurandes, F-34590 Marsillargues (FR). **BOUABOULA, Monsif** [FR/FR]; 4 Beal du Moulin, F-34990 Juvignac (FR). **CASELLAS, Pierre** [FR/FR]; 10 rue Carl von Linné, F-34090 Montpellier (FR). **TONNERRE, Bernard** [FR/FR]; 96 impasse le Vallon, F-34570 Vailhauques (FR). **OLSEN, Jacob-Alsboek** [DK/DE]; Leerbach, Str. 112, 60322 Francfort (DE). **MIGNANI, Serge** [FR/FR]; 14 avenue de Robinson, F-92290 Chatenay-Malabry (FR).

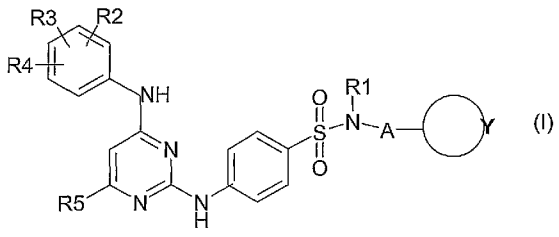
(74) Mandataire : **BOURGOUIN-MULLER, Alessandra**; sanofi-aventis, 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(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,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: NOVEL 2,4-DIANILINOPYRIMIDINE DERIVATIVES, THE PREPARATION THEREOF, THEIR USE AS MEDICAMENTS, PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS AND, IN PARTICULAR, AS IKK INHIBITORS

(54) Titre : NOUVEAUX DERIVES DE 2,4-DIANILINOPYRIMIDINES, LEUR PREPARATION, A TITRE DE MEDICAMENTS, COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES ET NOTAMMENT COMME INHIBITEURS DE IKK



(I)

(57) Abstract: The invention relates to products of formula (I) in which: R2, R3 and R4 represent one hydrogen and the others represent hydrogen, halogen, alkyl or alkoxy; R5 represents hydrogen or halogen; R1 represents hydrogen, cycloalkyl, alkyl, alkenyl or alkynyl, all of which being optionally substituted; A represents a single bond or -CH2-CO-NR6- with R6 being selected among the values of R1; the cycle containing Y (or (Y) cycle)) having 4 to 8 members with Y representing O, S, SO, SO2, N-R7 ((Y) cycle) that can contain a carbon bridge), C=O or the dioxolane therefor, CF2, CH-OR8, CH-NR8R9, and; R7 represents hydrogen, cycloalkyl, alkyl, CH2-alkenyl or CH2-alkynyl, all of which being optionally substituted; R8 represents hydrogen, alkyl, cycloalkyl or heterocycloalkyl, all of which being optionally substituted, these products existing in all isomeric forms and the salts. The invention also relates to the use of the aforementioned derivatives as medicaments, in particular, as IKK inhibitors.

[Suite sur la page suivante]

WO 2007/006926 A3

CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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, LV, 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*

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 22 mars 2007

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.

(57) Abrégé : L'invention concerne les produits de formule (I) dans laquelle R2, R3 et R4 représentent l'un hydrogène et les autres hydrogène, halogène, alkyle ou alcoxy; R5 représente hydrogêne ou halogène; Rl représente hydrogène, cycloalkyle, alkyle, alkényle ou alkynyle, tous éventuellement substitués ; A représente simple liaison ou -CH2-CO-NR6- avec R6 est choisi parmi les valeurs de Rl; le cycle renfermant Y (ou cycle (Y)) ayant 4 à 8 chaînons avec Y représente O, S, SO, SO2 , N-R7 (cycle (Y) pouvant renfermant un pont carboné) , C=O ou son dioxolanne, CF2 , CH-0R8, CH-NR8R9 ; et R7 représente hydrogène, cycloalkyle, alkyle, CH2 -alkényle ou CH2- alkynyle, éventuellement substitués ; R8 représente hydrogène, alkyle, cycloalkyle ou hétérocycloalkyle éventuellement substitués,- ces produits étant sous toutes les formes isomères et les sels, à titre de médicaments notamment comme inhibiteurs de IKK.