

(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 novembre 2004 (18.11.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/099217 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :

C07D 513/04, A61K 31/549

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2004/001070

(22) Date de dépôt international : 4 mai 2004 (04.05.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

03/05448

5 mai 2003 (05.05.2003) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : **LES LABORATOIRES SERVIER** [FR/FR]; 12, place de la Défense, F-92415 Courbevoie Cedex (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : **GRAIN-DORGE, Emmanuel** [BE/BE]; 25, rue Bois d'Avroy, B-4000 Liege (BE). **FRANCOTTE, Pierre** [BE/BE]; Avenue Blondin, 82-5a, B-4000 Liege (BE). **BOVERIE, Stéphane** [BE/BE]; La Rock, 19, B-4160 Anthistes

(BE). **DE TULLIO, Pascal** [BE/BE]; Voie du Herdier, 22, B-4020 Jupille (BE). **PIROTTE, Bernard** [BE/BE]; Rue Tollet 5, B-4680 Oupeye (BE). **LESTAGE, Pierre** [FR/FR]; 9, allée de la Grande Terre, F-78170 La Celle St Cloud (FR). **DANOBER, Laurence** [FR/FR]; 82, rue Henri Richaume, F-78360 Montesson (FR). **RENARD, Pierre** [FR/FR]; 3, avenue du Parc, F-78150 Le Chesnay (FR). **CAIGNARD, Daniel-Henri** [FR/FR]; 22, avenue de la République, F-78230 Le Pecq (FR).

(74) Représentant commun : **LES LABORATOIRES SERVIER**; 12, place de la Défense, F-92415 Courbevoie Cedex (FR).

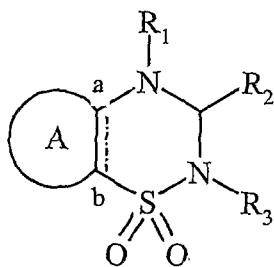
(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR,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

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: THIADIAZINE DERIVATIVES AND USE THEREOF AS POSITIVE AMPA RECEPTOR MODULATORS

(54) Titre : DERIVES DE THIADIAZINE ET LEUR UTILISATION COMME MODULATEURS POSITIFS DES RECEPTEURS AMPA



(I)

(57) Abstract: The invention relates to thiadiazine derivatives and to the use thereof as positive AMPA receptor modulators. More specifically, the invention relates to compounds having formula (I), wherein: A represents a thienyl, furyl, pyrrolyl, oxathiole, thiazole, isothiazole, oxazole or imidazole group; $\bullet \text{ } \zeta$ represents a single bond or a double bond; R₁ represents a hydrogen atom, a linear or branched (C₁-C₆) alkyl group which is optionally substituted by one or more halogen atoms, or a (C₁-C₆) alkoxy (C₁-C₆) alkyl group; R₂ represents a hydrogen atom or a linear or branched (C₁-C₆) alkyl group which is optionally substituted by one or more halogen atoms; and R₃ represents a hydrogen atom or a group which is selected from linear or branched (C₁-C₆) alkyl, CONHR' or SO₂NHR', in which R' represents a

linear or branched (C₁-C₆) alkyl group. The invention also relates to the enantiomers and diastereoisomers of the above-mentioned compounds as well as to the pharmaceutically-acceptable base or acid addition salts thereof. The invention further relates to the use of same as medicaments.

(57) Abrégé : Composés de formule (I) dans laquelle A représente un groupement thiényl, furyl, pyrrolyl, oxathiole, thiazole, isothiazole, oxazole ou imidazole, $\bullet \text{ } \zeta$ représente une liaison simple ou une liaison double, R₁ représente un atome d'hydrogène, un groupement alkyle (C₁-C₆) linéaire ou ramifié, éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène, ou un groupement alkoxy (C₁-C₆) alkyle (C₁-C₆), R₂ représente un atome d'hydrogène ou un groupement alkyle (C₁-C₆) linéaire ou ramifié, éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène, R₃ représente un atome d'hydrogène ou un groupement choisi parmi alkyle (C₁-C₆) linéaire ou ramifié, CONHR' ou SO₂NHR' dans lesquels R' représente un groupement alkyle (C₁-C₆) linéaire ou ramifié, leurs énantiomères, diastéréoisomères ainsi que leurs sels d'addition à un acide ou à une base pharmaceutiquement acceptable. Médicaments.

WO 2004/099217 A1



GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasién (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, 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.