

(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
8 septembre 2006 (08.09.2006)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2006/092507 A1

(51) Classification internationale des brevets :

C07D 253/06 (2006.01) A61P 3/04 (2006.01)
A61K 31/66 (2006.01) A61P 3/10 (2006.01)
A61P 3/06 (2006.01) A61P 17/00 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2006/000469

(22) Date de dépôt international : 2 mars 2006 (02.03.2006)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

0502152 3 mars 2005 (03.03.2005) FR

(71) Déposant : PIERRE FABRE MEDICAMENT [FR/FR];
45, place Abel Gance, F-92100 Boulogne-Billancourt (FR).

(72) Inventeurs; et

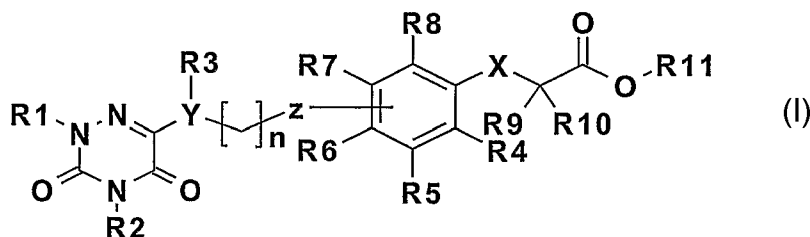
(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) :
DUPONT-PASSELAIGUE, Elisabeth [FR/FR]; 58,
rue de Kervenoael, F-81100 Castres (FR). LEROY,
Isabelle [FR/FR]; 39, Hameau de Fedevieille, F-81710
Saix (FR). PATOISEAU, Jean-François [FR/FR]; 7,
rue Jules-Ferry, F-81100 Castres (FR). JUNQUERO,
Didier [FR/FR]; 112 Chemin des Fourches, 81100 Castres
(FR). RIVAL, Yves [FR/FR]; 40, rue François Mitterand,
F-81090 Lagarrigue (FR). DELHON, André [FR/FR];
36, rue Hector-Berlioz, F-81100 Castres (FR).

(74) Mandataire : MARTIN, Jean-Jacques et al.; Cabinet
Regimbeau, 20, rue de Chazelles, F-75847 Paris Cedex 17
(FR).

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: 1,2,4-TRIAZINE DERIVATIVES, PREPARATION AND USE THEREOF IN HUMAN THERAPY

(54) Titre : DERIVES DE 1,2,4-TRIAZINES, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE HUMAINE



(57) Abstract: The invention concerns 3,5-dioxo-(2H,4H)-1,2,4-triazine derivatives of general formula (I), wherein: R₁ and R₂, identical or different, represent a branched or linear C₁-C₇ alkyl or alkenyl radical, a C₁-C₆ alkyl radical substituted by groups such as trifluoromethyl, C₅-C₆ cycloalkyl, nitrile, C₁-C₄ alkoxy-carbonylvinyl,

hydroxycarbonylvinyl, C₁-C₄ alkoxy-carbonyl, carboxylate, benzyloxy or phenyl (for which the phenyl ring is optionally substituted by one or more groups such as C₁-C₄ alkoyl, C₁-C₄ alkoxy, nitro, halogen, trifluoromethyl); YR₃ represents oxygen or NR₃ for which R₃ represents hydrogen, a linear or branched C₁-C₇ alkyl or alkenyl radical, a C₁-C₆ alkyl radical substituted by groups such as trifluoromethyl or phenyl (for which the phenyl ring is optionally substituted by one or more groups such as C₁-C₄ alkoyl, C₁-C₄ alkoxy, nitro, halogen, trifluoromethyl); Z represents an oxygen atom or a carbon atom capable of being bound to the ortho, meta or para positions of the phenyl group of formula I; n can be 0 to 5 when Z=C or 2 to 4 when Z=O; X represents oxygen or sulphur; R₄, R₅, R₆, R₇ and R₈ represent hydrogen or fluorine; R₉, R₁₀ and R₁₁ represent hydrogen or a linear or branched C₁-C₅ alkyl group as well as the pharmaceutically acceptable base addition salts, and the various enantiomers of compounds having asymmetric carbons, and their mixtures in all proportions including in particular the racemic mixtures.

(57) Abrégé : L'invention concerne des dérivés de la 3,5-dioxo-(2H,4H)-1,2,4-triazine de formule générale (I) dans laquelle - R₁ et R₂ peuvent être identiques ou différents et représentent un radical alkyle ou alkényle linéaire ou branché en C₁-C₇, un radical alkyle en C₁-C₆ substitué par des groupements tels que, trifluorométhyle, cycloalkyle en C₅-C₆, nitrile, alkoxy-carbonylvinyle en C₁-C₄, hydroxycarbonylvinyle, alkoxy-carbonyl en C₁-C₄, carboxylate, benzyloxy ou phényle (pour lesquels le noyau phényle est éventuellement substitué par un ou plusieurs groupements tels que alcoyle en C₁-C₄, alkoxy en C₁-C₄, nitro, halogène, trifluorométhyle). - YR₃ représente l'oxygène ou NR₃ pour lequel R₃ représente l'hydrogène, un radical alcoyle ou alkényle linéaire ou branché en C₁-C₇, un radical alkyle en C₁-C₆ substitué par des groupements tels que, trifluorométhyle ou phényle (pour lesquels le noyau phényle est éventuellement substitué par un ou plusieurs groupements tels que alcoyle en C₁-C₄, alkoxy en C₁-C₄, nitro, halogène, trifluorométhyle) - Z représente un atome d'oxygène ou un atome de carbone pouvant être lié aux positions ortho, meta ou para du groupement phényle de la formule I - n peut-être égal à 0 à 5 lorsque Z=C ou 2 à 4 lorsque Z=O, - X représente l'oxygène ou le soufre - R₄, R₅, R₆, R₇ et R₈ représentent l'hydrogène ou le fluor, - R₉, R₁₀ et R₁₁ représentent l'hydrogène ou un groupement alkyle en C₁-C₅ linéaire ou branché ainsi que les sels d'addition avec les bases pharmaceutiquement acceptables, et les différents énantiomères des composés possédant des carbones asymétriques, ainsi que leurs mélanges en toutes proportions incluant

[Suite sur la page suivante]



(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, KN, KP, KR, KZ, 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, 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), 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, 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

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.