

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
19. Februar 2009 (19.02.2009)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2009/021740 A3

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 307/12 (2006.01) A61P 3/00 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2008/006700

(22) Internationales Anmeldedatum:

14. August 2008 (14.08.2008)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

07291010.2 15. August 2007 (15.08.2007) EP

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): SANOFI-AVENTIS [FR/FR]; 174, avenue de France, 75013 Paris (FR).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHWINK, Lothar

[DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **STENGELIN, Siegfried** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **GOSSEL, Matthias** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **HAACK, Torsten** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **LENNIG, Petra** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE).

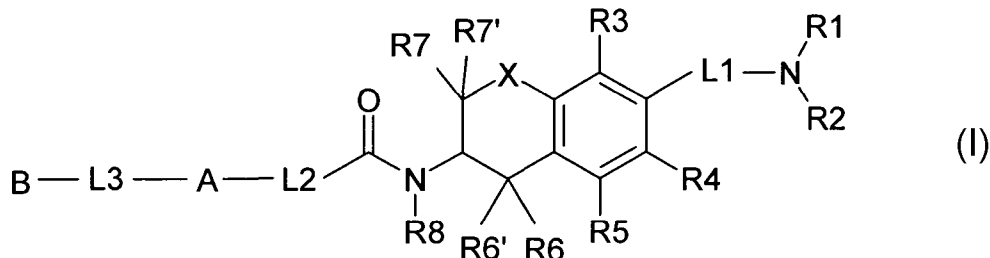
(74) Anwalt: **FISCHER, Hans-Jürgen**; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, Patentabteilung, Industriepark Höchst, Geb. K 801, 65926 Frankfurt am Main (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: SUBSTITUTED TETRAHYDRONAPHTHALENES, PROCESS FOR THE PREPARATION THEREOF AND THE USE THEREOF AS MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE TETRAHYDRONAPHTHALINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL



(57) Abstract: The invention relates to substituted tetrahydronaphthalenes of formula (I), the physiologically tolerated salts thereof, the use thereof, medicaments containing at least one substituted tetrahydronaphthalene according to the invention and the use of the substituted tetrahydronaphthalenes according to the invention and derivatives thereof as MCH antagonists, wherein in the case that X = O, C(R43)(R43'), B = (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, hydroxy-(C₁-C₆)alkyl, a 3- to 10-membered mono-, bi- or spirocyclic non-aromatic ring, which can contain 0 to 3 heteroatoms, selected from the group oxygen, nitrogen and sulfur, wherein the ring system can be additionally substituted with one or several of the following substituents: F, CF₃, (C₁-C₆)alkyl, O-(C₁-C₈)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, oxo, CO(R64), hydroxy; wherein in the case that X = C(R43)(R43'), L3 = C(R62)(R63)O, and a 4- to 10-membered mono-, bi- or spirocyclic non-aromatic ring, which contains 1 to 3 heteroatoms, selected from the group oxygen, nitrogen and sulfur, wherein the ring system can be additionally substituted with one or several of the following substituents: F, CF₃, (C₁-C₆)alkyl, (C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, oxo, CO(R64), hydroxy.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft substituierte Tetrahydronaphthaline der Formel (I), sowie deren physiologisch verträgliche Salze, deren Herstellung, Arzneimittel enthaltend mindestens ein erfindungsgemäßes substituiertes Tetrahydronaphthalin und die Verwendung der erfindungsgemäßen substituierten Tetrahydronaphthaline und deren Derivate als MCH-Antagonisten, wobei im Fall X = O, C(R43)(R43'), B = (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Hydroxy-(C₁-C₆)-alkyl, ein 3- bis 10-gliedriger mono-, bi- oder spirocyclischer nicht-aromatischer Ring, welcher 0 bis 3 Heteroatome beinhalten kann, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, wobei das Ringsystem zusätzlich substituiert sein kann mit einem oder mehreren der folgenden Substituenten: F, CF₃, (C₁-C₆)-Alkyl, O-(C₁-C₈)-Alkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)-alkyl, Oxo, CO(R64), Hydroxy; wobei im Fall X

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

WO 2009/021740 A3



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

ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

- (84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,

- (88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen**

Recherchenberichts:

14. Mai 2009