(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
9 octobre 2003 (09.10.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2003/082874 A3

(51) Classification internationale des brevets[7] :
C07D 487/04, 209/18, 487/04, 241/00, 209/00

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/001027

(22) Date de dépôt international : 2 avril 2003 (02.04.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/04158 3 avril 2002 (03.04.2002) FR

(71) Déposant *(pour tous les États désignés sauf US)* : **SANOFI-SYNTHELABO** [FR/FR]; 174 avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : **FROISSANT, Jacques** [FR/FR]; Cedex 981, Brevainville, F-41160 Morée (FR). **MARABOUT, Benoit** [FR/FR]; 45bis, rue de Versailles, F-91300 Massy (FR). **MARGUET, Frank** [FR/FR]; 17, rue Paul Doumer, F-91370 Verrières Le Buisson (FR). **PUECH, Frédéric** [FR/FR]; 3, allée d'Auvergne, F-78170 La Celle Saint Cloud (FR).

(74) Mandataire : **LUDWIG, Jacques**; Sanofi-Synthelabo, 174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(81) États désignés *(national)* : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, 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, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés *(régional)* : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

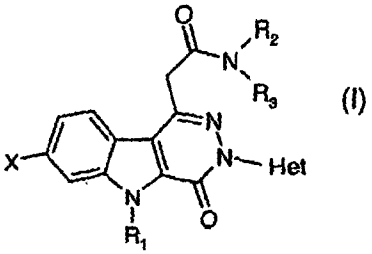
Publiée :
— *avec rapport de recherche internationale*

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 1 avril 2004

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.

(54) Title: 3-HETEROARYL-3,5-DIHYDRO-4-OXO-4H-PYRIDAZINO[4,5-B]INDOLE-1-ACETAMIDE DERIVATIVES, PREPARATION AND USE THEREOF IN MEDICAMENTS

(54) Titre : DERIVES DE 3-HETEROARYL-3,5-DIHYDRO-4-OXO-4H-PYRIDAZINO[4,5-b]INDOLE-1-ACETAMIDE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE



(57) Abstract: The invention relates to compounds of general formula (I), where X = H, or halogen, R_1= H, or (C_1-C_4)alkyl, R_2 and R_3independently = H or a (C_1-C_4) alkyl group, or R_2 and R_3 form, together with the nitrogen atom carrying them, a pyrrolidinyl, piperidinyl, morpholino or 4-(C_1-C_4)alkylpiperazinyl group and Het = a heteroaromatic group, being a pyridinyl, quinolinyl, isoquinolinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl group, the heteroaromatic group optionally having one or several halogen atoms and/or one or several (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4)alkoxy groups as substituents, in the base state, as addition salts with acids, solvates or hydrates, pharmaceutical compositions comprising the above, methods for production thereof and synthetic intermediates thereof.

(57) Abrégé : L'invention a pour objet les composés de formule générale (I) dans laquelle X représente un atome d'hydrogène ou d'halogène ; R_1représente un atome d'hydrogène ou un groupe (C_1-C_4)alkyle ; R_2 et R_3représentent chacun, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène ou un groupe (C_1-C_4)alkyle, ou bien R_2 et R_3 forment, avec l'atome d'azote qui les porte, un groupe pyrrolidinyle, pipéridinyle, morpholinyle ou 4-(C_1-C_4)alkylpipérazinyle ; et Het représente un groupe hétéroaromatique de type pyridinyle, quinolinyle, isoquinolinyle, pyrimidinyle, pyrazinyle, pyridazinyle, le groupe hétéroaromatique pouvant porter un ou plusieurs atomes d'halogènes et/ou un ou plusieurs groupes (C_1-C_4)alkyle, (C_1-C_4)alcoxyle ; à l'état de bases, de sels d'addition à des acides, de solvats ou d'hydrates ; les compositions pharmaceutiques les contenant, des procédés pour leur préparation et des intermédiaires de synthèse. Les composés de l'invention sont des ligands affins pour les récepteurs de type périphérique aux benzodiazépines.

WO 2003/082874 A3