(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
14 octobre 2004 (14.10.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/087647 A2

(51) Classification internationale des brevets[7] : C07D

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2004/000783

(22) Date de dépôt international : 29 mars 2004 (29.03.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
03/03812 28 mars 2003 (28.03.2003) FR

(71) Déposant *(pour tous les États désignés sauf US)* : **AVENTIS PHARMA S.A.** [FR/FR]; 20, avenue Raymond Aron, F-92160 Antony (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : **BIGOT, Antony** [FR/FR]; 8, rue Jean Rostand, F-91300 Massy (FR). **CHEVE, Michel** [FR/FR]; 3, rue Paul Belmondon, F-91450 Soisy sur Seine (FR). **EL AHMAD, Youssef** [FR/FR]; 11, avenue de Verdun, F-94000 Creteil (FR). **MALLERON, Jean-Luc** [FR/FR]; 2, allée Renoir, F-91460 Marcoussis (FR). **MARTIN, Jean-Paul** [FR/FR]; 14, avenue de l'agent Sarre, F-92700 Colombes (FR). **MIGNANI, Serge** [FR/FR]; 14, avenue de Robinson, F-92290 Chatenay Malabry (FR). **PANTEL, Guy** [FR/FR]; 12, rue Jean-Baptiste Clément, F-94510 La Queue en Brie (FR). **RONAN, Baptiste** [FR/FR]; 15, allée des Noisetiers, F-92140 Clamart (FR). **TABART, Michel** [FR/FR]; 3, rue Paul Langevin, F-91290 La Norville (FR). **VIVIANI, Fabrice** [FR/FR]; 46, rue Jules Fossier, F-95380 Louvre (FR).

(74) Mandataire : **DAVID, François**; Aventis Pharma S.A., Direction des Brevets, 20, avenue Raymond Aron, F-92165 Antony Cedex (FR).

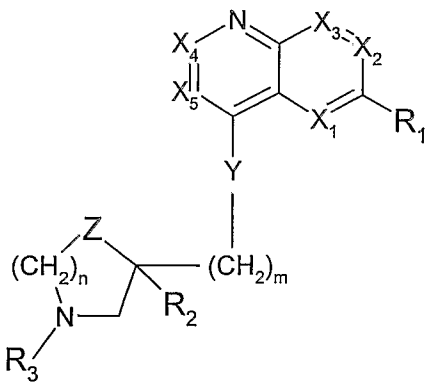
(81) États désignés *(sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible)* : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR,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

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: 4-SUBSTITUTED QUINONOLINE DERIVATIVES, PREPARATION METHODS AND INTERMEDIATES AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING SAME

(54) Titre : DERIVES DE QUINOLEINES-4-SUBSTITUEES, LEURS PROCEDES ET INTERMEDIAIRES DE PREPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT



(I)

(57) Abstract: The invention concerns 4-substituted quinoline derivatives active as antimicrobial agents, of general formula (I), wherein: X_1, X_2, X_3, X_4 and X_5 respectively represent >C-R'$_1$ to >C-R'$_5$, or not more than one represents N; Y represents CHR, CO, CROH, $CRNH_2$, CRF or CF_2, R being hydrogen or alkyl; m is 1, 2, or 3 and n is 0, 1 or 2; Z is CH_2 or Z represents O, S, SO, SO_2 and, in that case, n is equal to 2; R_2 represents $-CO_2R$, $-CH_2CO_2R$, $-CH_2-CH_2CO_2R$, $-CH_2OH$ or $-CH_2-CH_2OH$, R being as defined above; R_3 represents phenyl, heteroaryl or alk-R°$_3$, wherein alk is an alkyl and R°$_3$ represents various groups, optionally oxygenated, sulphured or aminated, in their enantiomeric or diastereoisomeric forms or mixtures thereof, and optionally in their syn or anti forms or mixtures thereof, as well as their salts.

(57) Abrégé : L'invention concerne des dérivés de quinoléines-4-substituées de formule générale : qui sont actifs comme anti-microbiens, dans laquelle : X_1, X_2, X_3, X_4 et X_5 représentent respectivement >C-R'$_1$ à >C-R'$_5$, ou bien l'un au plus représente N, Y représente CHR, CO, CROH, $CRNH_2$, CRF ou CF_2, R étant Hydrogène ou alcoyle, m est 1, 2 ou 3 et n est 0,1 ou 2, Z est CH_2 ou Z représente O, S, SO, SO_2 et, dans ce cas, n est égal à 2, R_2 représente $-CO_2R$, $-CH_2CO_2R$, $-CH_2-CH_2CO_2R$, $-CH_2OH$ ou $-CH_2-CH_2OH$, R étant tel que défini plus haut, R_3 représente phényle, hétéroaryle ou alk-R°$_3$, où alk est alcoyle et R°$_3$ représente divers groupements, le cas échéant oxygénés, soufrés ou aminés, sous leurs formes énantiomères ou diastéréoisomères ou leurs mélanges, et/ou le cas échéant sous forme syn ou anti ou leurs mélanges, ainsi que leurs sels.

WO 2004/087647 A2

KE, LS, MW, MZ, 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, 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 :

— *sans rapport de recherche internationale, sera republiée dès réception de ce rapport*

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.