

(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 août 2003 (14.08.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 03/066561 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07C 50/28, C07D 213/50, A61K 31/122, A61P 3/10

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR03/00331

(22) Date de dépôt international : 4 février 2003 (04.02.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/01409 6 février 2002 (06.02.2002) 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) : **DAS-SONVILLE, Alexandra** [FR/FR]; 3, rue Louis Blanc, F-44200 Nantes (FR). **BRETECHE, Anne** [FR/FR]; 6, chemin du Doucet, F-44700 Orvault (FR). **DUFLOS, Muriel** [FR/FR]; Route de Nantes, La Croix Rouge, F-44640 Vue (FR). **LE BAUT, Guillaume** [FR/FR]; 5, rue de la Baugerie, F-44230 Saint Sébastien sur Loire

(FR). **PFEIFFER, Bruno** [FR/FR]; 47, rue Ernest Renan, F-95320 Saint Leu la Fôret (FR). **RENARD, Pierre** [FR/FR]; 3, avenue du Parc, F-78150 Le Chesnay (FR). **LEVENS, Nigel** [GB/FR]; Villa des Mioches, 33, allée de Saint Cucufa, F-92420 Vaucresson (FR). **HUS-SON-ROBERT, Bernadette** [FR/FR]; 34, rue du Vieux Pont, F-92000 Nanterre (FR).

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

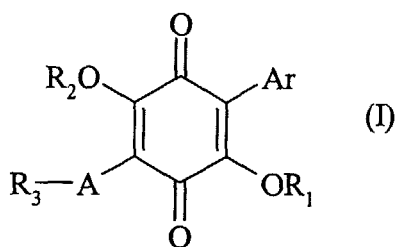
(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, 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, SE, SI, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: NOVEL 3-ARYL-2,5-DIHYDROXY-1,4-BENZOQUINONE DERIVATIVES, THEIR PREPARATION METHOD AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING SAME

(54) Titre : NOUVEAUX DERIVES DE 3-ARYL-2,5-DIHYDROXY-1,4-BENZOQUINONES, LEUR PROCÉDE DE PRÉPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT



(57) Abstract: The invention concerns a compound of formula (I), wherein: R₁ and R₂, identical or different, represent each a hydrogen atom or an acyl or alkyl group; Ar represents an aryl or heteroaryl group; A represents a group selected from formula (II); R₄ represents a hydrogen atom or an alkyl group; R₅ represents a hydrogen atom or a group selected among alkyl, aryl and heteroaryl; R₃ represents an aryl, heteroaryl, dicyclopropylmethyl or benzhydryl group, or A-R₃ represents an optionally substituted naphthyl group, excluding 2,5-dihydroxy-3-(4-methoxyphenyl)-6-(2-phenylethenyl)-1,4-benzoquinone, 2,5-dihydroxy-3-(4-methoxyphenyl)-6-(2-naphthyl)-1,4-benzoquinone, and 2,5-dihydroxy-3-(2-naphthyl)-6-phenyl-1,4-benzoquinone. The inventive compound is useful for preparing medicines.

(57) Abrégé : Composé de Formule (I) dans laquelle : R₁ et R₂ identiques ou différents, représentent chacun un atome d'hydrogène ou un groupement acyle ou alkyle, Ar représente un groupement aryle ou hétéroaryle, A représente un groupement choisi parmi la Formule (II), R₄ représente un atome d'hydrogène ou un groupement alkyle, R₅ représente un atome d'hydrogène ou un groupement choisi parmi alkyle, aryle et hétéroaryle, R₃ représente un groupement aryle, hétéroaryle, dicyclopropylméthyle ou benzhydryle, ou A-R₃ représente un groupement naphthyle éventuellement substitué, à l'exclusion de la 2,5-dihydroxy-3-(4-méthoxyphényl)-6-(2-phényléthényl)-1,4-benzoquinone, de la 2,5-dihydroxy-3-(4-méthoxyphényl)-6-(2-naphtyl)-1,4-benzoquinone, et de la 2,5-dihydroxy-3-(2-naphtyl)-6-phényl-1,4-benzoquinone.



WO 03/066561 A1

**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.