27 MAR 2002

20020017424

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

162162

(43) Date de la publication internationale
19 avril 2001 (19.04.2001)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 01/26656 A3

(51) Classification internationale des brevets[7] :
A61K 31/426, 31/421, 31/42, 31/417, A61P 25/00, C07D 277/28

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR00/02805

(22) Date de dépôt international :
10 octobre 2000 (10.10.2000)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :

99/12643	11 octobre 1999 (11.10.1999)	FR
00/10151	1 août 2000 (01.08.2000)	FR
00/11169	1 septembre 2000 (01.09.2000)	FR

(71) Déposant *(pour tous les États désignés sauf US)* : SOCIETE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'APPLICATIONS SCIENTIFIQUES (S.C.R.A.S.) [FR/FR]; 51/53, rue du Docteur Blanche, F-75016 Paris (FR).

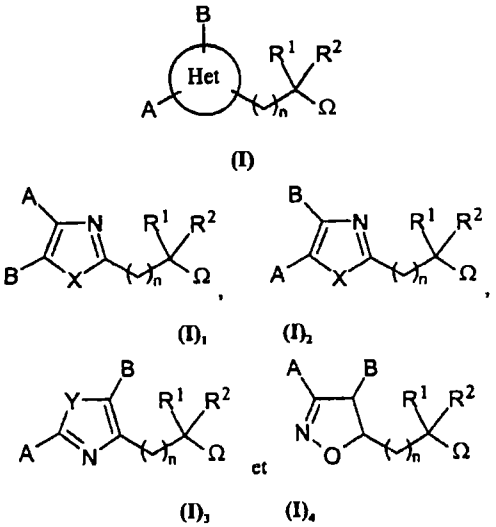
(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : CHABRIER de LASSAUNIERE, Pierre-Etienne

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: 5-MEMBERED HETEROCYCLE DERIVATIVES AND USE THEREOF AS MONOAMINE OXIDASE INHIBITORS

(54) Titre : DERIVES D'HETEROCYCLES A 5 CHAINONS ET LEUR APPLICATION COMME INHIBITEURS DE MONOAMINE OXYDASE



(57) Abstract: The invention relates to compounds of general formula (I) which can be used for producing a medicament for inhibiting monoamine oxydases (MAO) and/or for lipidic peroxydation and/or for acting as modulators of sodium channels. The resulting medicament is particularly for use for treating Parkinson's disease, senile dementure, Alzheimer's disease, Huntington's chorea, amytrophic lateral sclerosis, schizophrenia, depression, psychosis, pain and epilepsy. The inventive compounds correspond to general formula (I), wherein Het is a 5-membered heterocycle comprising 2 heteroatoms and is such that general formula (I) corresponds exclusively to one of the following sub-formulae: $(I)_1$, $(I)_2$, $(I)_3$ and $(I)_4$, wherein A represents especially a substituted phenyl or biphenyl radical, B represents especially H or an alkyl radical, X represents especially NH or S, Y represents O or S, n is a whole number from 0 to 6, R^1 and R^2 represent, independently of each other, especially radicals chosen from the following: a hydrogen atom or an alkyl or cycloalkyl radical; and Ω represents $NR^{46}R^{47}$ or OR^{48}, R^{46} and R^{47} representing especially radicals chosen from the following: an atom of hydrogen and an alkyl, cycloalkyl, alkynyl, cyanoalkyl alkoxycarbonyl, aralkoxycarbonyl or (cycloalkyl)oxycarbonyl radical and R^{48} representing a hydrogen atom or an alkyl, alkynyl or cyanoylkynyl radical.

(57) Abrégé : Les composés répondant à la formule générale (I) peuvent être utilisés pour préparer un médicament destiné à inhiber les monoamine oxydases (MAO) et/ou peroxydation lipidique et/ou à agir en tant que modulateurs des canaux sodiques. En particulier le médicament préparé sera destiné à traiter la maladie de Parkinson, les démences séniles, la maladie d'Alzheimer, la chorée de Huntington, la sclérose latérale amyotrophique, la schizophrénie, les dépressions, les psychoses, la douleur et l'épilepsie. Les composés de l'invention répondent à la formule générale (I) dans laquelle Het est un hétérocycle à 5 chaînons comportant 2 hétéroatomes et tel que la formule générale (I) corresponde exclusivement à l'une des sous-formules $(I)_1$, $(I)_2$, $(I)_3$ et $(I)_4$ dans lesquelles A représente notamment un radical phényle ou biphényle substitué, B représente notamment H ou un radical alkyle, X représente notamment NH ou S, Y représente O ou S, n est un entier de 0 à 6, R^1 et R^2 représentent indépendamment, notamment, des radicaux choisis parmi un atome d'hydrogène ou radical alkyle ou cycloalkyle, et Ω représente $NR^{46}R^{47}$ ou OR^{48}, R^{46} et R^{47} représentant, notamment, des radicaux choisis parmi un atome d'hydrogène et un radical alkyle, cycloalkyle, alkynyle, cyanoalkyle alkoxycarbonyle, aralkoxycarbonyle ou (cycloalkyl)oxycarbonyle et R^{48}

[Suite sur la page suivante]

WO 01/26656 A3

ACTION