(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
17 juillet 2003 (17.07.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 03/057697 A1

(51) Classification internationale des brevets[7] : **C07D 471/08**, A61K 31/439, A61P 25/00 // (C07D 471/08, 221:00, 209:00)

(21) Numéro de la demande internationale : PCT/FR03/00004

(22) Date de dépôt international : 3 janvier 2003 (03.01.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/00109 7 janvier 2002 (07.01.2002) 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)* : **GALLI, Frédéric** [FR/FR]; 6, avenue de Rueil, F-92420 Vaucresson (FR). **LECLERC, Odile** [FR/FR]; 11, rue Winston Churchill, F-91300 Massy (FR). **LOCHEAD, Alistair** [GB/FR]; 95, rue de Paris, F-94220 Charenton le Pont (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, 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.

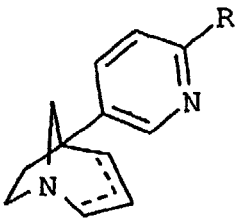
(84) États désignés *(régional)* : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG,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

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.

(54) **Title:** DERIVATIVES OF 5-(PYRIDIN-3-YL)-1-AZABICYCLO[3.2.1]OCTANE, THE PREPARATION THEREOF AND THE APPLICATION OF SAME IN THERAPEUTICS

(54) **Titre :** DERIVES DE 5-(PYRIDIN-3-YL)-1-AZABICYCLO [3.2.1] OCTANE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to compounds having general formula (I), wherein R denotes a halogen atom, a phenyl group which is substituted by one or more groups selected from among halogen atoms and the (C_1-C_6) alkyl, (C_1-C_6) alcoxy, nitro, amino, trifluoromethyl, cyano, hydroxy, acetyl or methylenedioxy groups, a pyridinyl group, a thienyl group, a indolyl group, or a pyrimidinyl group which is optionally substituted by one or more (C_1-C_6) alcoxy groups. Moreover, among the two carbon-carbon bonds denoted by ----, one is simple and the other can be simple or double. The inventive compounds are nicotinic receptor ligands.

(57) Abrégé : Composés répondant à la formule générale (I) dans laquelle R représente soit un atome d'halogène ou un groupe phényle substitué par un ou plusieurs groupes choisis parmi les atomes d'halogènes et les groupes (C_1-C_6)alkyle, (C_1-C_6)alcoxy, nitro, amino, trifluorométhyle, cyano, hydroxy, acétyle ou méthylènedioxy, soit un groupe pyridinyle, soit un groupe thiényle, soit un groupe indolyle, ou un groupe pyrimidinyle éventuellement substitué par par un ou plusieurs groupes (C_1-C_6)alcoxy, sachant que, parmi les deux liaisons carbone-carbone représentées par ----, l'une est simple et l'autre peut être simple ou double. Les composés de l'invention sont des ligands pour les récepteurs nicotiniques.

WO 03/057697 A1