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

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

PCT

(43) Date de la publication internationale
2 mars 2006 (02.03.2006)

(10) Numéro de publication internationale
WO 2006/021657 A1

(51) Classification internationale des brevets :
C07D 451/04 (2006.01) *A61P 3/04* (2006.01)
A61K 31/46 (2006.01) *A61P 3/10* (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01) *A61P 15/00* (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2005/001856

(22) Date de dépôt international : 20 juillet 2005 (20.07.2005)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0408372 29 juillet 2004 (29.07.2004) FR

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

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : **BRAUN, Alain** [FR/FR]; 83, avenue Victor Hugo, F-92100 Boulogne Billancourt (FR). **CORNET, Bruno** [FR/FR]; 41 rue de Saint-Germain, F-77930 PERTHES-EN-GATINAIS (FR). **COURTEMANCHE, Gilles** [FR/FR]; 53 rue Aignan Serres, F-31120 Lacroix-Falgarde (FR). **CRESPIN, Olivier** [FR/FR]; 8 Châteaux Bruloir, F-95000 Cergy (FR). **PASCAL, Cécile** [FR/FR]; 3, rue Gustave Flaubert, F-92500 Rueil-Malmaison (FR).

(74) Mandataire : **GUILLAUME, Geneviève**; Sanofi-Aventis, 174 avenue de France, F-75013 Paris (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, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

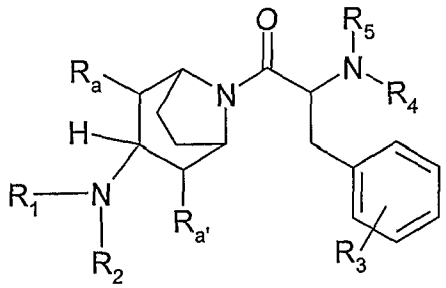
(84) États désignés *(sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible)* : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, 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 :
— *avec rapport de recherche internationale*

[Suite sur la page suivante]

(54) **Title:** AMINO-TROPANE DERIVATIVES, PREPARATION THEREOF AND THERAPEUTIC USE THEREOF

(54) **Titre :** DERIVES D'AMINO-TROPANE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEUTIQUE



(I)

(57) **Abstract:** The invention concerns amino-tropane derivatives of general formula (I), wherein: R_a $R_{a'}$ et R_5 represent hydrogen atoms or alkyl groups; R_1 represents a hydrogen atom or an alkyl, cycloalkyl, heterocycloalkyl or aryl group; R_2 represents a group of formula $-(CH_2)_x-(CO)_y-Y$ or $-(CO)_y-(CH_2)_x-Y$, wherein Y represents a hydrogen atom or a hydroxy, alkyl, cycloalkyl, alkoxy, aryl, heteroaryl group or $NR_{11}R_{12}$; R_3 represents 1 to 3 groups selected among halogen atoms and alkyl, cycloalkyl OR, -NRR', -CO-NRR', -NR-CO-R', -NR-CO-NRR', -NR-COOR', $-NO_2$, -CN and -COOR groups; R_4 is selected among a group of formula (a), (b), (c) or (d): or a group of formula $-A-R_{18}$, $-A-CH=N-R_{19}$, $-A-N(R_{20})-A'-R_{19}$, $-A-CO-N(R_{2O})-A'-R_{19}$, $-A-CH(NH_2)-R_{19}$, $-A-N(R_{20})-COO-A'$ or $-(CH_2)$r-heteroaryl. The invention also concerns a method for preparing said derivatives and the therapeutic use thereof.

(57) **Abrégé :** L'invention concerne des dérivés d'amino-tropane de formule générale (I) : dans laquelle : R_a $R_{a'}$ et R_5 représentent des atomes d'hydrogène ou des groupes alkyles, R_1 représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle, cycloalkyle, hétérocycloalkyle ou aryle, R_2 représente un groupe de formule $-(CH_2)_x-(CO)_y-Y$ ou $-(CO)_y-(CH_2)_x-Y$, dans laquelle Y représente un atome d'hydrogène ou un groupe hydroxy, alkyle, cycloalkyle, alcoxy, aryle, hétéroaryle ou $-NR_{11}R_{12}$, R_3 représente 1 à 3 groupes choisis parmi les atomes d'halogène et les groupes alkyles, cycloalkyles, -OR, -NRR', -CO-NRR', -NR-CO-R', -NR-CO-NRR', -NR-COOR', $-NO_2$, -CN et -COOR, R_4 est choisi parmi un groupe de formule (a), (b), (c) ou (d) : ou un groupe de formule $-A-R_{18}$, $-A-CH=N-R_{19}$, $-A-N(R_{20})-A'-R_{19}$, $-A-CO-N(R_{2O})-A'-R_{19}$, $-A-CH(NH_2)-R_{19}$, $-A-N(R_{20})-COO-A'$ ou $-(CH_2)$r-hétéroaryle. Procédé de préparation et application en thérapeutique.

WO 2006/021657 A1

— *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.