

(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
6 janvier 2011 (06.01.2011)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2011/001114 A1

(51) Classification internationale des brevets :

C07D 239/36 (2006.01) A61K 31/5377 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) C07D 239/47 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01) C07D 403/06 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01) C07D 403/10 (2006.01)
A61K 31/513 (2006.01) C07D 413/06 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :

PCT/FR2010/051375

(22) Date de dépôt international :

1 juillet 2010 (01.07.2010)

(25) Langue de dépôt :

français

(26) Langue de publication :

français

(30) Données relatives à la priorité :

0903239 2 juillet 2009 (02.07.2009) FR
61/241,100 10 septembre 2009 (10.09.2009) US
0957070 9 octobre 2009 (09.10.2009) 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) : CARRY,
Jean-Christophe [FR/FR]; c/o Sanofi-Aventis,
Département Brevets, 174 Avenue de France, F-75013
Paris (FR). CERTAL, Victor [FR/FR]; c/o Sanofi-
Aventis, Département Brevets, 174 Avenue de France,

F-75013 Paris (FR). HALLEY, Frank [FR/FR]; c/o
Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174 Avenue de
France, F-75013 Paris (FR). KARLSSON, Karl Andreas
[SE/FR]; c/o Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174
Avenue de France, F-75013 Paris (FR). SCHIO, Laurent
[FR/FR]; c/o Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174
Avenue de France, F-75013 Paris (FR). THOMPSON,
Fabienne [FR/FR]; c/o Sanofi-Aventis, Département
Brevets, 174 Avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(74) Mandataire : BOURGOUIN-MULLER, Alessandra; c/
o sanofi-aventis, Département Brevets, 174 avenue de
France, F-75013 Paris (FR).

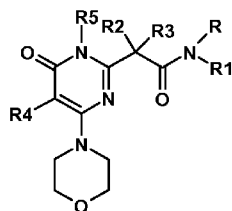
(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM,
AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ,
CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP,
KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD,
ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI,
NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD,
SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR,
TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), européen (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title : NOVEL (6-OXO-1, 6-DIHYDRO-PYRIMIDIN-2-YL)-AMIDE DERIVATIVES, PREPARATION THEREOF, AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF AS AKT(PKB) PHOSPHORYLATION INHIBITORS

(54) Titre : NOUVEAUX DERIVES DE (6-OXO-1,6-DIHYDRO-PYRIMIDIN-2-YL)-AMIDE, LEUR PREPARATION ET LEUR UTILISATION PHARMACEUTIQUE COMME INHIBITEURS DE PHOSPHORYLATION D'AKT(PKB)



(I)

(57) Abstract : The invention relates to the novel materials of formula (I), where: R1 is an optionally substituted aryl or heteroaryl; R is an H or, when formed with R1, a 5- or 6-member ring fused with an aryl or heteroaryl group optionally containing one or more of O, S, N, NH, and Nalk, being optionally substituted; R2 and R3 are, independently, an H, Hal, or alkyl optionally substituted by one or more Hal; R4 is H; and R5 is an H or alkyl optionally substituted by one or more halogen atoms. Said materials being in any isomeric form and the salts thereof, and are intended for drugs, particularly AKT(PKB) phosphorylation inhibitors.

(57) Abrégé : L'invention concerne les nouveaux produits de formule (I): dans laquelle R1 représente aryle ou hétéroaryle éventuellement substitués; R représente H ou bien forme avec R1 un cycle à 5 ou 6 chaînons fusionné à un reste aryle ou hétéroaryle renfermant éventuellement un ou plusieurs O, S, N, NH et Nalk, étant éventuellement substitué; R2, R3 représentent indépendamment H, Hal ou alkyle éventuellement substitué par un ou plusieurs Hal; R4 représente H; R5 représente un H ou alkyle éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène; ces produits étant sous toutes les formes isomères et les sels, à titre de médicaments notamment comme inhibiteurs de phosphorylation d'AKT(PKB).

WO 2011/001114 A1