PCT WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION

International Bureau

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International patent classification[7]: C07D 265/30, 413/06, A61K 31/5375, 31/5377, A61P 11/00, 25/00 — A1

(11) International publication number: WO 00/58292

(43) International publication date: 5 October 2000 (05.10.00)

(21) International application number: PCT/FR00/00695

(22) International filing date: 21 March 2000 (21.03.00)

(30) Data relating to the priority:
99/03,854 25 March 1999 (25.03.99) FR

(71) Applicant (for all designated States except US): SANOFI-SYNTHELABO [FR/FR]; 174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (US only): DUCOUX, Jean, Philippe [FR/FR]; 272, rue des Eucalyptus, F-34090 Montpellier (FR) EMONDS-ALT, Xavier [FR/FR]; La Balajade, F-34980 Combaillaux (FR). GUEULE, Patrick [FR/FR]; 6, rue des Amandiers, F-34820 Teyran (FR). PROIETTO, Vincenzo [IT/FR]; 1, Cour de Merle, F-34680 Saint Georges d'Orques (FR).

(74) Representative: THOURET-LEMAITRE, Elisabeth; Sanofi-Synthelabo, 174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

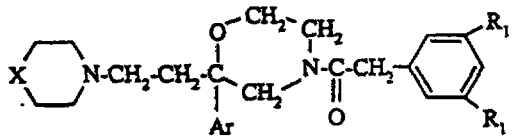
(81) Designated states: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published
With the International Search Report.

As printed

(54) Title: NOVEL MORPHOLINE DERIVATIVES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND PHARMACEUTICAL PREPARATIONS CONTAINING SAID DERIVATIVES

(54) Titre: NOUVEAUX DERIVES DE MORPHOLINE, PROCEDE POUR LEUR PREPARATION ET COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES LES CONTENANT



(I)

(57) Abstract

The invention relates to compounds of formula (I) and the salts thereof with mineral or organic acids, the solvates and/or hydrates thereof, exhibiting a strong affinity and high degree of selectivity with respect to human NK_1 receptors of substance P. The invention also relates to a method for the production of said derivatives, intermediate compounds of formulae (IV), (VI) and (VIII) used in the production thereof, pharmaceutical compositions containing said derivatives and the use thereof in the production of medicaments in the treatment of all pathologies where substance P and/or human NK_1 receptors are involved.

(57) Abrégé

L'invention concerne les composés de formule (I) ainsi que leurs sels avec des acides minéraux ou organiques, leurs solvats et/ou leurs hydrates, présentant une forte affinité et une grande sélectivité pour les récepteurs NK_1 humains de la Substance P. L'invention concerne également leur procédé de préparation, les composés intermédiaires de formules (IV), (VI) et (VIII) utiles pour leur préparation, les compositions pharmaceutiques les contenant et leur utilisation pour la fabrication de médicaments destinés à traiter toute pathologie où la Substance P et/ou les récepteurs NK_1 humains sont impliqués.