

(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
12 août 2004 (12.08.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/067498 A2

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07C 271/10, 269/06,
269/00, C07D 263/44, A61K 31/27, 31/33

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2004/000139

(22) Date de dépôt international :
22 janvier 2004 (22.01.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
03/00704 23 janvier 2003 (23.01.2003) 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

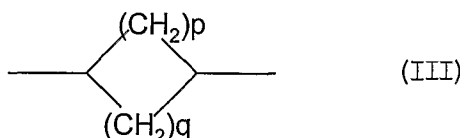
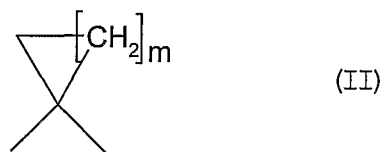
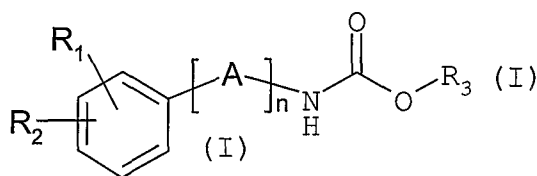
(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : **ABOUAB-
DELLAH, Ahmed** [FR/FR]; 2, rue des Eglantiers,
F-94320 Thiais (FR). **ALMARIO GARCIA, Antonio**
[ES/FR]; 26, avenue Roger Salengro, F-92290 Chateaufort
Malabry (FR). **HOORNAERT, Christian** [BE/FR]; 49,
avenue Aristide Briand, F-92160 Antony (FR). **RAVET,
Antoine** [FR/FR]; 9, rue J.Margottin, F-92340 Bourg la
Reine (FR).

(74) Mandataire : **LUDWIG, Jacques**; Sanofi-Synthelabo,
174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: ARYL ALKYL CARBAMATE DERIVATIVES PRODUCTION AND USE THEREOF IN THERAPY

(54) Titre : DERIVES D'ARYLALKYLCARBAMATES, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION EN THERAPEU-
TIQUE



(57) Abstract: The invention relates to compounds of general formula (I), where n = a whole number from 1 to 7, A is selected from one or several groups X, Y and/or Z, X = C₁₋₂ alkylene, optionally substituted by one or more C₁₋₁₂ alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl or C₃₋₇ cycloalkyl-C₁₋₆ alkylene groups, Y = C₂ alkenylene, optionally substituted by one or several C₁₋₁₂ alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl or C₃₋₇ cycloalkyl-C₁₋₆ alkylene groups, Z = a C₃₋₇ cycloalkyl group of formula, (II), (III), m = a whole number from 1 to 5, p and q are whole numbers defined such that p+q is a number from 1 to 5, R₁ = H, halogen, hydroxyl, cyano, nitro, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ thioalkyl, C₁₋₄ fluoroalkyl, C₁₋₄ fluoroalkoxy, C₁₋₄ fluorothioalkyl, R₂ = H, halogen, cyano, nitro, hydroxyl, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ thioalkyl, C₁₋₄ fluoroalkyl, C₁₋₄ fluoroalkoxy, C₁₋₄-fluorothioalkyl, or an aryl or heteroaryl group, optionally substituted by one or several substituents, R₃ is a group of general formula CHR₄CONHR₅, where R₄ = H, or C₁₋₃ alkyl and R₅ = H, or C₁₋₃ alkyl, C₃₋₅ cycloalkyl, C₃₋₇-cycloalkyl-C₁₋₆ alkylene, the base, the acid addition salt, the hydrate or the solvate thereof. For application in therapy.

(57) Abrégé : Composé répondant à la formule générale (I) dans laquelle n représente un nombre entier allant de 1 à 7 ; A est choisi

parmi un ou plusieurs groupes X, Y et/ou Z ; X représente un groupe C₁₋₂-alkylène éventuellement substitué par un ou plusieurs groupes C₁₋₁₂-alkyle, C₃₋₇-cycloalkyle ou C₃₋₇-cycloalkyl-C₁₋₆-alkylène ; Y représente un groupe C₂-alcénylène éventuellement substitué par un ou plusieurs groupes C₁₋₁₂ alkyle, C₃₋₇-cycloalkyle ou C₃₋₇-cycloalkyl-C₁₋₆-alkylène ; Z représente un groupe C₃₋₇-cycloalkyle, de formule, m représente un nombre entier allant de 1 à 5 ; p et q représentent des nombres entiers et sont définis tels que p+q soit un nombre allant de 1 à 5 ; R₁ représente un atome d'hydrogène, d'halogène ou un groupe hydroxyle, cyano, nitro, C₁₋₄-alkyle, C₁₋₄-alkoxy, C₁₋₄-thioalkyle, C₁₋₄-fluoroalkyle, C₁₋₄-fluoroalkoxy, C₁₋₄-fluorothioalkyle ; R₂ représente un atome d'hydrogène, d'halogène, ou un groupe cyano, nitro, hydroxyle, C₁₋₄-alkyle, C₁₋₄-alkoxy, C₁₋₄-thioalkyle, C₁₋₄-fluoroalkyle, C₁₋₄-fluoroalkoxy, C₁₋₄-fluorothioalkyle, ou un groupe de type aryle ou hétéroaryle éventuellement substitué par un ou plusieurs substituants ; R₃ représente un groupe de formule générale CHR₄CONHR₅ dans laquelle R₄ représente un atome d'hydrogène ou un groupe C₁₋₃-alkyle et R₅ représente un atome d'hydrogène ou un groupe C₁₋₃-alkyle, C₃₋₅-cycloalkyle, C₃₋₇-cycloalkyle-C₁₋₆-alkylène ;

[Suite sur la page suivante]

WO 2004/067498 A2



- (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, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, 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, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasién (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, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

— sans rapport de recherche internationale, sera republiée dès réception de ce rapport

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.