

(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 février 2004 (12.02.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/013100 A3

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07D 211/26, A61K 31/4402, A61P 25/00

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/002355

(22) Date de dépôt international : 25 juillet 2003 (25.07.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/09589 29 juillet 2002 (29.07.2002) 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) :
DACHARY, Emmanuelle [FR/FR]; 8, villa Bertrand,
F-94100 Saint-Maur (FR). **DARGAZANLI, Gihad**
[FR/FR]; 47, boulevard de la Vanne, F-94230 Cachan (FR).
ESTENNE-BOUHTOU, Geneviève [FR/FR]; 18, rue des
Jardins, F-94550 Chevilly-Larue (FR). **MARABOUT,**
Benoît [FR/FR]; 45bis, rue de Versailles, F-91300 Massy
(FR). **RAKOTOARISOA, Nathalie** [FR/FR]; 7 boulevard
de Bretagne, F-91160 Longjumeau (FR). **ROGER, Pierre**
[FR/FR]; 6, rue Paul-Valéry, F-78180 Montigny-le-Bre-
tonneux (FR). **SEVRIN, Mireille** [FR/FR]; 3, rue Francis
de Pressensé, F-75014 Paris (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, 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 (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, RO, SE, SI, SK,
TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

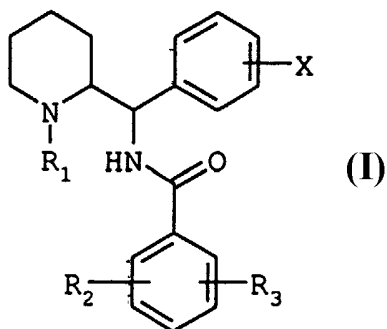
— avec rapport de recherche internationale
— avant l'expiration du délai prévu pour la modification des
revendications, sera republiée si des modifications sont re-
çues

(88) Date de publication du rapport de recherche
internationale: 15 avril 2004

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: *N*-[PHENYL(PIPERIDIN-2-YL)METHYL]BENZAMIDE DERIVATIVES, PREPARATION THEREOF, AND USE THEREOF IN THERAPY

(54) Titre : DERIVES DE *N*-[PHENYL(PIPERIDIN-2-YL)METHYL]BENZAMIDE, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLI-
CATION EN THERAPEUTIQUE



(57) Abstract: Disclosed are compounds of general formula (I) in which R₁ represents H or an alkyl, cycloalkyl alkyl, phenylalkyl, alkenyl, or alkynyl, X represents H or one or several halogen atoms, alkyl, or alkoxy, R₂ represents H or one or several halogen atoms or alkoxy groups, or optionally substituted amino, R₃ represents an optionally substituted aminosulfonyl group, a cyano group or a group of formula S-alkyl, an alkylsulfonyl group, a carboxy or alkoxy carbonyl group, an optionally substituted carbamoyl group, an acetyl or benzoyl group, or an alkyl, cycloalkyl, alkenyl, phenyl, thienyl or thianthrenyl group. Said compounds are used for therapeutic purposes.

(57) Abrégé : Composés de formule générale (I) où R₁ représente H ou un alkyle, cycloalkyle, phénylalkyle, alcényle ou alcynyle, X représente soit H ou un ou plusieurs atomes d'halogènes, alkyle ou alcoxy, R₂ représente H ou un ou plusieurs atomes d'halogènes ou groupes alcoxy, ou amino éventuellement substitué, R₃ représente soit un groupe aminosulfonyle éventuellement substitué, soit

un groupe cyano ou un groupe de formule S-alkyle, soit un groupe alkylsulfonyle, soit un groupe carboxy ou alkoxy carbonyle, soit un groupe carbamoyle éventuellement substitué, soit un groupe acétyle ou benzoyle, soit un groupe alkyle, cycloalkyle, alcényle, phényle, thiényle ou thianthrényle. Application en thérapeutique.

WO 2004/013100 A3



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.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Internat. application No
PCT/FR 03/02355

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 C07D211/26 A61K31/4402 A61P25/00		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07D A61K A61P		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	O. FRIELICH ET AL.: "Asymmetric synthesis. 39. Synthesis of 2-(1-aminoalkyl)piperidines via 2-cyano-6-phenyl oxazolopiperidine" J. ORG. CHEM., vol. 61, 1996, pages 6700-6705, XP002235079 composé 18c ---	1,4,5
A	WO 99 45011 A (JANSSENS FRANS EDUARD ; JANSSEN PHARMACEUTICA NV (BE); KENNIS LUDO) 10 September 1999 (1999-09-10) page 1 ---	1,4
A	US 5 254 569 A (CHEESEMAN ROBERT S ET AL) 19 October 1993 (1993-10-19) cited in the application examples -----	1
☐ Further documents are listed in the continuation of box C. ☒ Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents : *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. *Z* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 27 February 2004		Date of mailing of the international search report 04/03/2004
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer de Nooy, A

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/FR 03/02355

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9945011	A	10-09-1999	AU 3254499 A	20-09-1999
			BG 104686 A	30-04-2001
			BR 9907953 A	24-10-2000
			CA 2322136 A1	10-09-1999
			CN 1291984 T	18-04-2001
			EE 200000483 A	15-02-2002
			WO 9945011 A1	10-09-1999
			EP 1058684 A1	13-12-2000
			HR 20000524 A1	28-02-2001
			HU 0101281 A2	28-09-2001
			JP 2002505332 T	19-02-2002
			NO 20004432 A	02-11-2000
			PL 342818 A1	02-07-2001
			SK 13092000 A3	12-03-2001
			TR 200002570 T2	21-12-2000
US 5254569	A	19-10-1993	AU 1199692 A	17-08-1992
			CA 2100551 A1	15-07-1992
			EP 0572449 A1	08-12-1993
			JP 6504287 T	19-05-1994
			WO 9212128 A1	23-07-1992

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No

PCT/FR 03/02355

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE

CIB 7 C07D211/26 A61K31/4402 A61P25/00

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)

CIB 7 C07D A61K A61P

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie °	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
X	O. FRIELICH ET AL.: "Asymmetric synthesis. 39. Synthesis of 2-(1-aminoalkyl)piperidines via 2-cyano-6-phenyl oxazolopiperidine" J. ORG. CHEM., vol. 61, 1996, pages 6700-6705, XP002235079 composé 18c	1,4,5
A	WO 99 45011 A (JANSSENS FRANS EDUARD ; JANSSEN PHARMACEUTICA NV (BE); KENNIS LUDO) 10 septembre 1999 (1999-09-10) page 1	1,4
A	US 5 254 569 A (CHEESEMANN ROBERT S ET AL) 19 octobre 1993 (1993-10-19) cité dans la demande exemples	1

☐ Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents

☒ Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe

° Catégories spéciales de documents cités:

A document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent

E document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date

L document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)

O document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens

P document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée

T document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention

X document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément

Y document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier

Z document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

27 février 2004

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

04/03/2004

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale

Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

de Nooy, A

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Renseignements relatifs aux membres de familles de brevets

Demande nationale No

PCT/FR 03/02355

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO 9945011	A	10-09-1999	AU 3254499 A	20-09-1999
			BG 104686 A	30-04-2001
			BR 9907953 A	24-10-2000
			CA 2322136 A1	10-09-1999
			CN 1291984 T	18-04-2001
			EE 200000483 A	15-02-2002
			WO 9945011 A1	10-09-1999
			EP 1058684 A1	13-12-2000
			HR 20000524 A1	28-02-2001
			HU 0101281 A2	28-09-2001
			JP 2002505332 T	19-02-2002
			NO 20004432 A	02-11-2000
			PL 342818 A1	02-07-2001
			SK 13092000 A3	12-03-2001
			TR 200002570 T2	21-12-2000
US 5254569	A	19-10-1993	AU 1199692 A	17-08-1992
			CA 2100551 A1	15-07-1992
			EP 0572449 A1	08-12-1993
			JP 6504287 T	19-05-1994
			WO 9212128 A1	23-07-1992