

(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
15 janvier 2009 (15.01.2009)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2009/007536 A3

(51) Classification internationale des brevets :
C07D 401/02 (2006.01) A61K 31/495 (2006.01)
C07D 471/02 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 403/02 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2008/000794

(22) Date de dépôt international : 11 juin 2008 (11.06.2008)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0704193 13 juin 2007 (13.06.2007) FR

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

(71) Déposant (pour US seulement) : ALAM, Antoine
[FR/FR]; c/o Sanofi-aventis, Département Brevets, 174
Avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : BONO,
Françoise [FR/FR]; c/o Sanofi-aventis, Département

Brevets, 174 Avenue de France, F-75013 Paris (FR).
DUCLOS, Olivier [FR/FR]; c/o Sanofi-Aventis, Département
Brevet, 174 Avenue de France, F-75013 Paris (FR).
MC CORT, Gary [US/FR]; c/o Sanofi-aventis, Département
Brevets, 174 Avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(74) Mandataire : BOURON, Estelle; c/o Sanofi-aventis, Dé-
partement Brevets, 174 Avenue de France, F-75013 Paris
(FR).

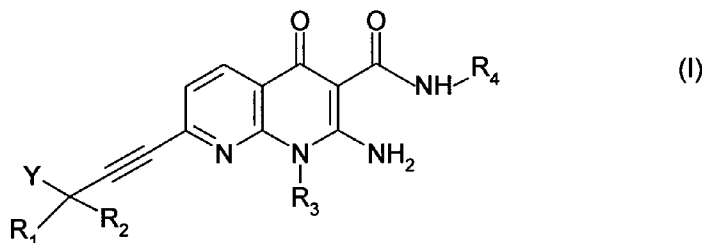
(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AO,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG,
ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL,
IN, IS, JP, KE, KG, KM, 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, PG, PH, PL,
PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY,
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, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: DERIVATIVES OF 7-ALKYNYL-1,8-NAPHTHYRIDONES, PREPARATION METHOD THEREOF AND USE OF SAME IN THERAPEUTICS

(54) Titre : DÉRIVÉS DE 7-ALKYNYL-1,8-NAPHTHYRIDONES, LEUR PRÉPARATION ET LEUR APPLICATION EN THÉRAPEUTIQUE



(57) Abstract: The invention relates to compounds having formula (I), in which: R₁ and R₂ represent, independently of each other, a hydrogen atom, an alkyl group at C1-C7, optionally substituted by one or more alkoxy groups; R₃ represents an alkyl group at C1-C7; R₄ represents a hydrogen atom, an alkyl group at C1-C4; Y represents an alkoxy group at C1-C4, a group -NRR', -O(CH₂)_n-C(O)-NRR', wherein R and R' are as defined below and n is an integer equal to 1 or 2; R'' represents an alkyl group at C1-C4; and R and R' represent, independently of each other, a hydrogen atom, a -CO-alkyl group at C1-C4 or a -COO'' group, wherein R'' is as defined above. The invention also relates to the preparation method thereof and to the use of same in therapeutics.

(57) Abrégé : L'invention concerne des composés répondant à la formule (I) : dans laquelle : R₁ et R₂ représentent indépendamment l'un de l'autre: un atome d'hydrogène, un groupe alkyle en C1-C7 éventuellement substitué par un ou plusieurs groupes alcoxy, R₃ représente un groupe alkyle en C1-C7; R₄ représente un atome d'hydrogène, un groupe alkyle en C1-C4; Y représente un groupe alcoxy en C1-C4, un groupe -NRR', -O(CH₂)_n-C(O)-NRR' où R et R' sont tels que définis ci-dessous et n est un nombre entier égal à 1 ou 2; R'' représente un groupe alkyle en C1-C4; et R et R' représentent indépendamment l'un de l'autre un atome d'hydrogène, un groupe -CO-alkyle en C1 -C4 ou un groupe -COOR'', où R'' tel que définis ci-dessus Procédé de préparation et application en thérapeutique.



WO 2009/007536 A3



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, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL,
NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale

**(88) Date de publication du rapport de recherche
internationale:**

19 mars 2009

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/FR2008/000794

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D401/02 C07D471/02 C07D403/02 A61K31/495 A61P35/00

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)

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

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2005/118587 A (TAKEDA PHARMACEUTICAL [JP]; NISHIKIMI YUJI [JP]; FUKUSHI HIDETO [JP];) 15 December 2005 (2005-12-15) the whole document <p style="text-align: center;">-----</p>	1-16

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family 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.
- * & * document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

19 janvier 2009

Date of mailing of the international search report

28/01/2009

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Lange, Tim

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/FR2008/000794

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005118587 A	15-12-2005	EP 1761539 A1	14-03-2007
		JP 2008501628 T	24-01-2008
		US 2007254877 A1	01-11-2007

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale n°

PCT/FR2008/000794

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE

INV. C07D401/02 C07D471/02 C07D403/02 A61K31/495 A61P35/00

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)

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 cela est réalisable, termes de recherche utilisés)

EPO-Internal

C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	WO 2005/118587 A (TAKEDA PHARMACEUTICAL [JP]; NISHIKIMI YUJI [JP]; FUKUSHI HIDETO [JP];) 15 décembre 2005 (2005-12-15) le document en entier -----	1-16

 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

& document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

19 janvier 2009

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

28/01/2009

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,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Lange, Tim

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Renseignements relatifs aux membres de familles de brevets

Demande internationale n°

PCT/FR2008/000794

Document brevet cité au rapport de recherche	Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO 2005118587 A	15-12-2005	EP 1761539 A1	14-03-2007
		JP 2008501628 T	24-01-2008
		US 2007254877 A1	01-11-2007
