

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
26. Februar 2009 (26.02.2009)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2009/024287 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 235/18 (2006.01) A61P 3/00 (2006.01)  
C07D 401/12 (2006.01) A61P 5/50 (2006.01)  
C07D 409/12 (2006.01) A61P 9/00 (2006.01)  
C07D 417/12 (2006.01) A61P 25/18 (2006.01)  
A61K 31/4439 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)

Paris (FR). **SANCHEZ-ARIAS, Juan-Antonio** [ES/ES]; Sanofi-Aventis, Avenida Industria (Zade Alcobendas), 31, E-28108 Alcobendas (ES).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2008/006685

(22) Internationales Anmeldedatum:  
14. August 2008 (14.08.2008)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
07291036.7 23. August 2007 (23.08.2007) EP  
08290181.0 25. Februar 2008 (25.02.2008) EP

(74) **Anwalt:** FISCHER, Hans-Jürgen; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, Patentabteilung, Industriepark Höchst, Geb. K 801, 65926 Frankfurt am Main (DE).

(81) **Bestimmungsstaaten** (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart*): 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, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(71) **Anmelder** (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): **SANOFI-AVENTIS** [FR/FR]; 174, avenue de France, F-75013 Paris (FR).

(84) **Bestimmungsstaaten** (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart*): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (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).

(72) **Erfinder; und**

(75) **Erfinder/Anmelder** (*nur für US*): **ZOLLER, Gerhard** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **VOSS, Marc, Dietrich** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **MATTER, Hans** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **HERLING, Andreas** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **PHILIPPO, Christophe** [FR/FR]; Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174, avenue de France, F-75013 Paris (FR). **NAMANE, Claudie** [FR/FR]; Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174, avenue de France, F-75013

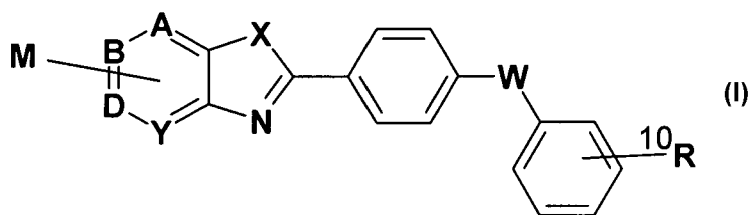
**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht  
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

(88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:** 7. Mai 2009

(54) **Title:** AZOLORAINE DERIVATIVES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF, PHARMACEUTICALS CONTAINING THESE COMPOUNDS, AND THE USE THEREOF

(54) **Bezeichnung:** AZOLOARIN DERIVATE, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG, DIESE VERBINDUNGEN ENTHALTENDE ARZNEIMITTEL UND DEREN VERWENDUNG



(57) **Abstract:** The invention relates to compounds of the formula (I), wherein the residues R, M, W, X, A, B, D, and Y have the stated meanings, and the physiologically compatible salts thereof. The compounds are suitable, for example, for the treatment of the metabolic syndrome, insulin resistance, obesity, and diabetes.

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft Verbindungen der Formel (I) worin die Reste R, M, W, X, A, B, D und Y die angegebenen Bedeutungen haben, sowie deren physiologisch verträgliche Salze. Die Verbindungen eignen sich z.B. zur Behandlung des metabolischen Syndrom, Insulinresistenz, Obesitas und Diabetes.

WO 2009/024287 A3

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No  
PCT/EP2008/006685

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

INV. C07D235/18 C07D401/12 C07D409/12 C07D417/12 A61K31/4439  
A61P3/00 A61P5/50 A61P9/00 A61P25/18 A61P25/28

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, WPI Data, BEILSTEIN 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.
A	WO 99/11627 A (ORTHO MCNEIL PHARM INC [US]) 11 March 1999 (1999-03-11) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche 1, 15; Seite 43, Beispiel 95(b). -----	1-31
X	WO 03/032984 A (ORTHO MCNEIL PHARM INC [US]) 24 April 2003 (2003-04-24) cited in the application Zusammenfassung; Ansprüche 1, 19; Seiten 84-85, Beispiele 69, 70; Seite 40, Zeilen 1-13. ----- -/--	1-4, 6-8, 19

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

9 Februar 2009

Date of mailing of the international search report

25/02/2009

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

Weisbrod, Thomas

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2008/006685

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>ARIENTI, K. L. ET AL.: "Checkpoint Kinase Inhibitors: SAR and Radioprotective Properties of a Series of 2-Arylbenzimidazoles"            J. MED. CHEM.,            vol. 48, 2005, pages 1873-1885,            XP002466182            cited in the application            Verbindungen 1g, 1h.</p>	1-31
A	<p>US 2006/019965 A1 (GARRICK LLOYD M [US] ET AL) 26 January 2006 (2006-01-26)            Zusammenfassung; Ansprüche 1, 8, 9, 25-32;            Seite 20; Tabelle 1: Verbindung 17.</p>	1-31
A	<p>WO 2006/014168 A (XENON PHARMACEUTICALS INC [CA]; FU JIAN-MIN [CA]; KODUMURU VISHNUMURTH) 9 February 2006 (2006-02-09)            Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.</p>	1-18
A	<p>WO 2007/056846 A (MERCK FROSST CANADA LTD [CA]; CRANE SHELDON N [CA]; ROBICHAUD JOEL STE) 24 May 2007 (2007-05-24)            Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.</p>	1-18
A	<p>ZHAO, H. ET AL.: "Discovery of 1-(4-phenoxy-piperidin-1-yl)-2-arylaminoethanone stearyl-CoA desaturase 1 inhibitors"            BIOORGANIC &amp; MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS,            OXFORD, GB,            vol. 17, no. 12,            15 June 2007 (2007-06-15), pages            3388-3391, XP022097789            ISSN: 0960-894X            the whole document</p>	1-18

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2008/006685

Patent document cited in search report	A	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9911627	A	11-03-1999	AU 9305498 A	22-03-1999
			US 5942532 A	24-08-1999
WO 03032984	A	24-04-2003	AT 369854 T	15-09-2007
			BR 0206161 A	01-02-2005
			CA 2464000 A1	24-04-2003
			DE 60221866 T2	29-05-2008
			EP 1435947 A1	14-07-2004
			ES 2292812 T3	16-03-2008
			JP 2005506349 T	03-03-2005
			NO 20032759 A	18-08-2003
			US 2003176438 A1	18-09-2003
			US 2008009493 A1	10-01-2008
			YU 49203 A	25-05-2006
			ZA 200305533 A	18-10-2004
US 2006019965	A1	26-01-2006	NONE	
WO 2006014168	A	09-02-2006	AU 2004321997 A1	09-02-2006
			BR PI0418939 A	08-04-2008
			CA 2573198 A1	09-02-2006
			CN 1997371 A	11-07-2007
			EP 1763350 A1	21-03-2007
			JP 2008505891 T	28-02-2008
WO 2007056846	A	24-05-2007	AU 2006315025 A1	24-05-2007
			CA 2628996 A1	24-05-2007
			EP 1951731 A1	06-08-2008

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2008/006685

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b>		
INV. C07D235/18 A61P3/00	C07D401/12 A61P5/50	C07D409/12 A61P9/00
C07D417/12 A61P25/18	A61K31/4439 A61P25/28	
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b>		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole ) C07D A61K A61P		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 99/11627 A (ORTHO MCNEIL PHARM INC [US]) 11. März 1999 (1999-03-11) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche 1, 15; Seite 43, Beispiel 95(b).	1-31
X	WO 03/032984 A (ORTHO MCNEIL PHARM INC [US]) 24. April 2003 (2003-04-24) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche 1, 19; Seiten 84-85, Beispiele 69, 70; Seite 40, Zeilen 1-13.	1-4, 6-8, 19
	----- -/--	
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
<ul style="list-style-type: none"> <li>* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :</li> <li>*A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</li> <li>*E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</li> <li>*L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)</li> <li>*O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht</li> <li>*P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</li> <li>*T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist</li> <li>*X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden</li> <li>*Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist</li> <li>*G* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</li> </ul>		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche		Absenddatum des internationalen Recherchenberichts
9. Februar 2009		25/02/2009
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter  Weisbrod, Thomas

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2008/006685

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	<p>ARIENTI, K. L. ET AL.: "Checkpoint Kinase Inhibitors: SAR and Radioprotective Properties of a Series of 2-Arylbenzimidazoles"            J. MED. CHEM.,            Bd. 48, 2005, Seiten 1873-1885,            XP002466182            in der Anmeldung erwähnt            Verbindungen 1g, 1h.</p> <p>-----</p>	1-31
A	<p>US 2006/019965 A1 (GARRICK LLOYD M [US] ET AL) 26. Januar 2006 (2006-01-26)            Zusammenfassung; Ansprüche 1, 8, 9, 25-32;            Seite 20; Tabelle 1: Verbindung 17.</p> <p>-----</p>	1-31
A	<p>WO 2006/014168 A (XENON PHARMACEUTICALS INC [CA]; FU JIAN-MIN [CA]; KODUMURU VISHNUMURTH) 9. Februar 2006 (2006-02-09)            Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.</p> <p>-----</p>	1-18
A	<p>WO 2007/056846 A (MERCK FROSST CANADA LTD [CA]; CRANE SHELDON N [CA]; ROBICHAUD JOEL STE) 24. Mai 2007 (2007-05-24)            Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele.</p> <p>-----</p>	1-18
A	<p>ZHAO, H. ET AL.: "Discovery of 1-(4-phenoxy piperidin-1-yl)-2-arylaminoethanone stearyl-CoA desaturase 1 inhibitors"            BIOORGANIC &amp; MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS,            OXFORD, GB,            Bd. 17, Nr. 12,            15. Juni 2007 (2007-06-15), Seiten            3388-3391, XP022097789            ISSN: 0960-894X            das ganze Dokument</p> <p>-----</p>	1-18

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2008/006685

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9911627	A	11-03-1999	AU 9305498 A	22-03-1999
			US 5942532 A	24-08-1999
WO 03032984	A	24-04-2003	AT 369854 T	15-09-2007
			BR 0206161 A	01-02-2005
			CA 2464000 A1	24-04-2003
			DE 60221866 T2	29-05-2008
			EP 1435947 A1	14-07-2004
			ES 2292812 T3	16-03-2008
			JP 2005506349 T	03-03-2005
			NO 20032759 A	18-08-2003
			US 2003176438 A1	18-09-2003
			US 2008009493 A1	10-01-2008
			YU 49203 A	25-05-2006
			ZA 200305533 A	18-10-2004
			US 2006019965	A1
WO 2006014168	A	09-02-2006	AU 2004321997 A1	09-02-2006
			BR PI0418939 A	08-04-2008
			CA 2573198 A1	09-02-2006
			CN 1997371 A	11-07-2007
			EP 1763350 A1	21-03-2007
			JP 2008505891 T	28-02-2008
WO 2007056846	A	24-05-2007	AU 2006315025 A1	24-05-2007
			CA 2628996 A1	24-05-2007
			EP 1951731 A1	06-08-2008