

# (12) International Application Status Report

**Received at International Bureau:** 12 July 2006 (12.07.2006)

**Information valid as of:** (..)

**Report generated on:** 15 December 2019 (15.12.2019)

<b>(10) Publication number:</b> WO2007/000582	<b>(43) Publication date:</b> 04 January 2007 (04.01.2007)	<b>(26) Publication language:</b> English (EN)
<b>(21) Application Number:</b> PCT/GB2006/002344	<b>(22) Filing Date:</b> 27 June 2006 (27.06.2006)	<b>(25) Filing language:</b> English (EN)
<b>(31) Priority number(s):</b> 0513176.8 (GB) 0521278.2 (GB) 0608846.2 (GB)	<b>(31) Priority date(s):</b> 28 June 2005 (28.06.2005) 19 October 2005 (19.10.2005) 04 May 2006 (04.05.2006)	<b>(31) Priority status:</b> Priority document received (in compliance with PCT Rule 17.1) Priority document received (in compliance with PCT Rule 17.1) Priority document received (in compliance with PCT Rule 17.1)

## **(51) International Patent Classification:**

**C07D 413/12** (2006.01); **C07D 417/12** (2006.01); **C07D 403/12** (2006.01); **A61K 31/506** (2006.01); **A61P 5/02** (2006.01)

## **(71) Applicant(s):**

TAKEDA CAMBRIDGE LIMITED [GB/GB]; 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0PA (GB) *(for all designated states except US)*

SHOWELL, Graham, Andrew [GB/GB]; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB) *(for US only)*

MILLER, David, John [GB/GB]; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB) *(for US only)*

GLEN, Angela [GB/GB]; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB) *(for US only)*

CUBILLO DE DIOS, Maria, Angeles [ES/GB]; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB) *(for US only)*

MERCHANT, Kevin [GB/GB]; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB) *(for US only)*

MANDAL, Ajay, Kumar [IN/GB]; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB) *(for US only)*

## **(72) Inventor(s):**

SHOWELL, Graham, Andrew; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB)

MILLER, David, John; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB)

GLEN, Angela; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB)

CUBILLO DE DIOS, Maria, Angeles; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB)

MERCHANT, Kevin; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB)

MANDAL, Ajay, Kumar; Paradigm Therapeutics Ltd. 418 Cambridge Science Park Milton Road Cambridge CB4 0GP (GB)

## **(74) Agent(s):**

GILL JENNINGS & EVERY LLP; Broadgate House 7 Eldon Street London EC2M 7LH (GB)

**(54) Title (EN):** HETEROCYCLIC NON-PEPTIDE GNRH ANTAGONISTS

**(54) Title (FR):** ANTAGONISTES NON-PEPTIDES HETEROCYCLIQUES DE GNRH

## **(57) Abstract:**

**(EN):** A compound of formula (I): wherein either B is absent and A and Z are the same or different and are each hydrogen, halogen, alkyl, hydroxy, alkoxy,  $-CN$ ,  $-C(R^c)_2OH$ ,  $-N(R^d)C(=X)R^c$ ,  $-C(=X)N(R^c)(R^d)$ ,  $-S(O)_m-R^c$ ,  $-N(R^c)(R^d)S(O)_2$ ,  $-S(O)_2N(R^c)(R^d)$ ,  $-N(R^e)_2$ , aryl optionally substituted with  $R^a$  or  $-O$ -aryl optionally substituted with  $R^a$ ; or B is present and is  $(CH_2)_n$ ,  $-C(R^b)_2$ - or  $-O$ -, or B taken together with A or Z can be  $-C=C(R^b)$ -,  $-C(R^b)=C$ -,  $-CH_2-CH(R^b)$ - or  $-CH(R^b)-CH_2$ -; D is  $-O$ - or  $-S(O)_m$ -; E is a bond or is  $-(CH_2)_n$ -,  $-N(R^d)$ -,  $-(CH_2)_nN(R^d)$ - or  $-N(R^d)(CH_2)_n$ -; F is  $-C(=X)$ -; G is  $-(CH_2)_n$ -,  $-N(R^d)$ -,  $-(CH_2)_nN(R^d)$ - or  $-N(R^d)(CH_2)_n$ -; J is a bond,  $-O$ -,  $-N(R^c)C(=X)$ -,  $-C(=X)N(R^c)$ -,  $-S(O)_m$ -,  $-N(R^c)S(O)_m$ -,  $-S(O)_nN(R^c)$ -,  $-N(R^e)$ - or  $-N(R^g)(R^h)$ ; K is a bond, alkylene, cycloalkylene, cycloalkenylene, arylene, heterocycloalkylene, heterocycloalkylene or heteroarylene; and L is hydrogen or a terminal group; has therapeutic utility.

**(FR):** Composé de formule (I) possédant une utilité thérapeutique. Dans ladite formule soit B est absent et A et Z sont identiques ou différents et représentent chacun hydrogène, halogène, alkyle, hydroxy, alkoxy,  $-CN$ ,  $-C(R^c)_2OH$ ,  $-N(R^d)C(=X)R^c$ ,  $-C(=X)N(R^c)(R^d)$ ,  $-S(O)_m-R^c$ ,  $-N(R^c)(R^d)S(O)_2$ ,  $-S(O)_2N(R^c)(R^d)$ ,  $-N(R^e)_2$ , aryle éventuellement substitué par  $R^a$  ou  $-O$ -aryle éventuellement substitué par  $R^a$ ; soit B est présent et représente  $-(CH_2)_n$ -,  $-C(R^b)_2$ - ou  $-O$ -, soit B conjointement avec A ou Z peut être représenté par  $-C=C(R^b)$ -,  $-C(R^b)=C$ -,  $-CH_2-CH(R^b)$ - ou  $-CH(R^b)-CH_2$ -; D représente  $-O$ - ou  $-S(O)_m$ -; E représente une liaison ou  $-(CH_2)_n$ -,  $-N(R^d)$ -,  $-(CH_2)_nN(R^d)$ - ou  $-N(R^d)(CH_2)_n$ -; F représente  $-C(=X)$ -; G représente  $-(CH_2)_n$ -,  $-N(R^d)$ -,  $-(CH_2)_nN(R^d)$ - ou  $-N(R^d)(CH_2)_n$ -; J représente une liaison,  $-O$ -,  $-N(R^c)C(=X)$ -,  $-C(=X)N(R^c)$ -,  $-S(O)_m$ -,  $-N(R^c)S(O)_m$ -,  $-S(O)_nN(R^c)$ -,  $-N(R^e)$ - ou  $-N(R^g)(R^h)$ ; K représente une liaison, alkylène, cycloalkylène, cycloalcénylène, arylène, hétérocycloalkylène, hétérocycloalkylène ou hétéroarylène; et L représente hydrogène ou un groupe terminal.

### International search report:

Received at International Bureau: 31 October 2006 (31.10.2006) [EP]

### International Report on Patentability (IPRP) Chapter II of the PCT:

Chapter II demand received: 02 February 2007 (02.02.2007)

### (81) Designated States:

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, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

European Patent Office (EPO) : AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR

African Intellectual Property Organization (OAPI) : BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG

African Regional Intellectual Property Organization (ARIPO) : BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW

Eurasian Patent Organization (EAPO) : AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM