20020098668

22 FEB 2002

(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
1. März 2001 (01.03.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/14337 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 213/74, 233/88, 239/42, 235/30, 521/00, 333/48, 409/12, A61K 31/4184, 31/4168, 31/44, 31/4402, 31/505, A61P 9/10, 35/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/07590

(22) Internationales Anmeldedatum:
4. August 2000 (04.08.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
199 39 980.8 24. August 1999 (24.08.1999) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **MERCK PATENT GMBH** [DE/DE]; Frankfurter Straße 250, D-64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **JONCZYK, Alfred** [DE/DE]; Scheppallee 57, D-64295 Darmstadt (DE). **SCHADT, Oliver** [DE/DE]; Eschenstrasse 22, D-63517 Rodenbach (DE). **GOODMAN, Simon** [GB/DE]; Friedrich-Ebert-Strasse 102a, D-64347 Griesheim (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH**; Frankfurter Strasse 250, D-64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, 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, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— *Mit internationalem Recherchenbericht.*
— *Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen.*

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.



162162



ACTION

WO 01/14337 A1

(54) Title: $\alpha_v\beta_3$ INTEGRIN INHIBITORS

(54) Bezeichnung: INHIBITOREN DES INTEGRINS $\alpha_v\beta_3$

(57) Abstract: The invention relates to novel compounds of formula (I) which are biologically active as $\alpha_v\beta_3$ integrin ligands X-Y-Z-R^1-CH_2-R^2(R^4)-CH_2-CO-R^5, whereby X, Y, Z, R^1, R^2, R^4 and R^5 have meanings cited in Claim (1). The invention also relates to the physiologically acceptable salts and solvates thereof.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung beschreibt neuartige Verbindungen der Formel (I): X-Y-Z-R^1-CH_2-R^2(R^4)-CH_2-CO-R^5, welche als Liganden des Integrins $\alpha_v\beta_3$ biologisch wirksam sind, worin X, Y, Z, R^1, R^2, R^4 und R^5 die in Anspruch (1) angegebenen Bedeutungen haben, sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze und Solvate.