(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
6. Oktober 2005 (06.10.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/092849 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 207/12, 403/12, A61K 31/401, 31/4025, A61P 7/02

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/002306

(22) Internationales Anmeldedatum:
4. März 2005 (04.03.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 014 945.3 26. März 2004 (26.03.2004) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **MEDERSKI, Werner** [DE/DE]; Katzenelnbogenweg 1, 64673 Zwingenberg (DE). **TSAKLAKIDIS, Christos** [GR/DE]; Im Langgewann 54, 69469 Weinheim (DE). **DORSCH, Dieter** [DE/DE]; Koenigsberger Strasse 17A, 64372 Ober-Ramstadt (DE). **CEZANNE, Bertram** [DE/DE]; Bahnstrasse 74, 64546 Moerfelden-Walldorf (DE). **GLEITZ, Johannes** [DE/DE]; Liebigstrasse 26, 64293 Darmstadt (DE).

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

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: 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, 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, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

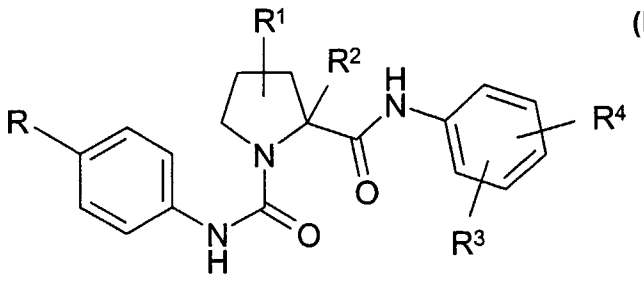
(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

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.

(54) **Title:** PROLINYL DERIVATIVES FOR TREATING THROMBOSIS

(54) **Bezeichnung:** PROLINYLDERIVATE ZUR BEHANDLUNG VON THROMBOSE



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to novel compounds of formula (I), in which R, R^1, R^2, R^3 and R^4 are defined as cited in claim 1. Said compounds are inhibitors of the coagulation factor Xa and can be used for the prophylaxis and/or treatment of thromboembolic diseases and for the treatment of tumours.

(57) **Zusammenfassung:** Neue Verbindungen der Formel (I), worin R, R^1, R^2, R^3 und R^4 die in Patentanspruch 1 angegebene Bedeutung haben, sind Inhibitoren des Koagulationsfaktors Xa und können zur Prophylaxe und/oder Therapie von thromboembolischen Erkrankungen und zur Behandlung von Tumoren eingesetzt werden.

WO 2005/092849 A1