

(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
4. März 2004 (04.03.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/018468 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 473/04**,
A61K 31/522, A61P 3/10

Schluesslerstrasse 28, 88433 Schemmerhofen (DE). **TA-
DAYYON, Mohammad** [GB/DE]; Schülinstrasse 31,
89083 Ulm (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/009127

(22) Internationales Anmeldedatum:
18. August 2003 (18.08.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 38 243.3 21. August 2002 (21.08.2002) DE
103 12 353.9 20. März 2003 (20.03.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH
& CO. KG** [DE/DE]; 55216 Ingelheim am Rhein (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **HIMMELSBACH,
Frank** [DE/DE]; Ahornweg 16, 88441 Mittelbiberach
(DE). **LANGKOPF, Elke** [DE/DE]; Schloss 3, 88447
Warthausen (DE). **ECKHARDT, Matthias** [DE/DE];
Kirschenweg 7, 88400 Biberach an der Riss (DE).
MARK, Michael [DE/DE]; Hugo-Haering-Strasse 50,
88400 Biberach an der Riss (DE). **MAIER, Roland**
[DE/DE]; Bodelschwingstr. 39, 88400 Biberach an der
Riss (DE). **LOTZ, Ralf, Richard, Hermann** [DE/DE];

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, 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, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT,
RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR,
TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

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

Veröffentlicht:

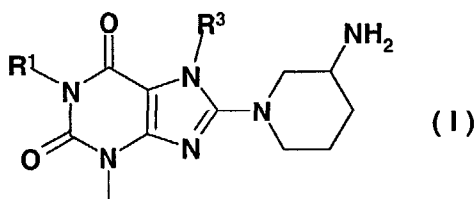
- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts: 8. April 2004

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

(54) Title: 8-[3-AMINO-PIPERIDIN-1-YL]-XANTHINES, THE PRODUCTION THEREOF AND THE USE OF THE SAME AS
MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: 8-[3-AMINO-PIPERIDIN-1-YL]-XANTHINE, DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG
ALS ARZNEIMITTEL



(57) Abstract: The invention relates to substituted xanthines of gen-
eral formula (I) wherein R¹ to R³ have the designations cited in patent
claims 1 to 16, and to the tautomers, stereoisomers, mixtures, prodrugs
and salts thereof, which have precious pharmacological properties, es-
pecially an inhibiting effect on the activity of the enzyme dipeptidylpep-
tidase-IV (DPP-IV).

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft substitu-
ierte Xanthine der allgemeinen Formel (I), in der R¹ bis R³ wie in den
Ansprüchen 1 bis 16 definiert sind, deren Tautomere, deren Stereoiso-
mere, deren Gemische, deren Prodrugs und deren Salze, welche wertvolle pharmakologische Eigenschaften aufweisen, insbesondere
eine Hemmwirkung auf die Aktivität des Enzyms Dipeptidylpeptidase-IV (DPP-IV).



WO 2004/018468 A3