2002019099

21 MAR 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

162162

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
19. April 2001 (19.04.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/27081 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 209/34, 401/12, 403/12, 405/12, A61K 31/404

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/09867

(22) Internationales Anmeldedatum:
9. Oktober 2000 (09.10.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
199 49 208.5 13. Oktober 1999 (13.10.1999) DE
100 42 696.4 31. August 2000 (31.08.2000) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **HECKEL, Armin** [DE/DE]; Geschwister-Scholl-Strasse 71, 88400 Biberach (DE). **ROTH, Gerald, Jürgen** [DE/DE]; Akazienweg 47, 88400 Biberach (DE). **WALTER, Rainer** [DE/DE]; Probstrasse 3, 88400 Biberach (DE). **VAN MEEL, Jacobus** [NL/AT]; Weisses Kreuz Gasse 61, A-2340 Mödling (AT). **REDEMANN, Norbert** [DE/DE]; Köhlesrain 48, 88400 Biberach (DE). **TONTSCH-GRUNT, Ulrike** [AT/AT]; Oetkerweg 23, A-2500 Baden (AT). **SPEVAK, Walter** [AT/AT]; Leoberndorferstrasse 36, A-2105 Oberrohrbach (AT). **HILBERG, Frank** [DE/AT]; Pilgramgasse 18/22, A-1050 Wien (AT).

(74) Anwalt: **LAUDIEN, Dieter**; Boehringer Ingelheim GmbH, B Patente, 55216 Ingelheim am Rhein (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, 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, 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.

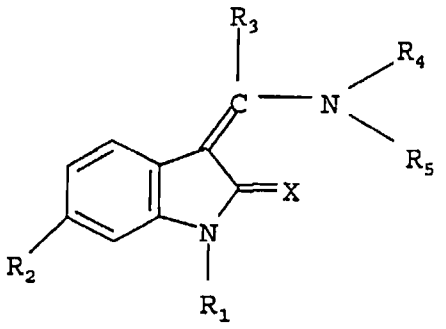
(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW,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

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) **Title:** 6-POSITION SUBSTITUTED INDOLINE, PRODUCTION AND USE THEREOF AS A MEDICAMENT

(54) **Bezeichnung:** IN 6-STELLUNG SUBSTITUIERTE INDOLINONE, IHRE HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to a 6-substituted indoline of formula (I), wherein R_1 to R_5 and X are as defined in claim 1, isomers and salts of said compound, in particular physiologically compatible salts of said compound having pharmacologically important characteristics, in particular inhibiting action on different receptor-tyrosine kinases and cyclin/CDK complexes in addition to inhibiting the proliferation of endothelial cells and different tumor cells. The invention also relates to medicaments containing said compounds, the use of said compounds and a method for the production thereof.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft in 6-Stellung substituierte Indolinone der allgemeinen Formel (I), in der R_1 bis R_5 und X wie im Anspruch 1 definiert sind, deren Isomere und deren Salze, insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze, welche Wertvolle pharmakologische Eigenschaften aufweisen, insbesondere eine inhibierende Wirkung auf verschiedene Rezeptor-Tyrosinkinasen und Cyclin/CDK-Komplexe sowie auf die Proliferation von Endothelzellen und verschiedener Tumorzellen, diese Verbindungen enthaltende Arzneimittel, deren Verwendung und Verfahren zu ihrer Herstellung.

WO 01/27081 A1

ACTION

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.