

(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
29. Juli 2004 (29.07.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/063171 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 239/80**,
243/02, 471/04, 285/36, 249/08, 403/12, 417/12, 405/12,
A61K 31/505, 31/55, 31/435, 31/54

SCHINDLER, Marcus [DE/DE]; Kapellenweg 3, 88400
Biberach (DE). STENKAMP, Dirk [DE/DE]; Boni-
faz-Locher-Weg 8, 88400 Biberach (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/000087

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BOEHRINGER INGEL-
HEIM INTERNATIONAL GMBH**; Binger Strasse 173,
55216 Ingelheim/Rhein (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:
9. Januar 2004 (09.01.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 00 973.6 14. Januar 2003 (14.01.2003) 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, 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, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNA-
TIONAL GMBH** [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216
Ingelheim/Rhein (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, 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, IT, LU, MC, NL, PT,
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **BAUER, Eckhart**
[DE/DE]; Nickeleshalde 11, 88400 Biberach (DE). **GER-
LACH, Kai** [DE/DE]; Sammlungsgasse 2, 89073 Ulm
(DE). **HURNAUS, Rudolf** [DE/DE]; Silcherstr. 19, 88400
Biberach (DE). **MUELLER, Stephan Georg** [DE/DE];
Mälzerstrasse 13, 88447 Warthausen (DE). **RUDOLF,
Klaus** [DE/DE]; Oeschweg 11, 88447 Warthausen (DE).

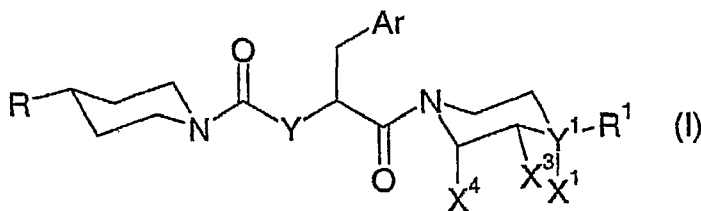
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: N- (1-BENZYL-2-OXO-2- (1-PIPERAZINYL) ETHYL) -1-PIPERIDINCARBOXAMID-DERIVATIVES AND RE-
LATED COMPOUNDS USE AS CGRP-ANTAGONISTS FOR TREATING A HEADACHE

(54) Bezeichnung: N- (1-BENZYL-2-OXO-2- (1-PIPERAZINYL) ETHYL) -1-PIPERIDINCARBOXAMID-DERIVATE UND
VERWANDTE VERBINDUNGEN ALS CGRP-ANTAGONISTEN ZUR BEHANDLUNG VON KOPFSCHMERZEN



(57) Abstract: The invention relates to
carboxylic acids and esters of a general formula
(I), wherein Ar, R, R¹, X¹, X³, X⁴, Y and Y¹ have
a definition given in a claim 1. Said invention
also relates to tautomers, the enantiomers,
mixtures and salts thereof, in particular to
physiologically compatible salts containing
organic or inorganic acids or bases, drugs
containing said compounds using them as CGRT

antagonists for treating a headache and to method for the production and use thereof for producing and cleaning antibodies and as
labelled compounds for RIA and ELISA biological dosages and, finally as auxiliary diagnostics or analytics for neurotransmitters.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Carbonsäuren und Ester der allgemeinen Formel (I), in der Ar, R, R¹,
X¹, X³, X⁴, Y und Y¹ wie in Anspruch 1 definiert sind, deren Tautomere, deren Diastereomere, deren Enantiomere, deren Gemische
und deren Salze, insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze mit anorganischen oder organischen Säuren oder Basen, diese
Verbindungen enthaltende Arzneimittel, deren Verwendung als CGRP-Antagonisten zur Behandlung von Kopfschmerzen und Ver-
fahren zu ihrer Herstellung sowie deren Verwendung zur Erzeugung und Reinigung von Antikörpern und als markierte Verbindungen
in RIA- und ELISA-Assays und als diagnostische oder analytische Hilfsmittel in der Neurotransmitter-Forschung.

WO 2004/063171 A1



— 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.