

(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
24. Oktober 2002 (24.10.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/083627 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07C 275/16**,
A61K 31/17, 31/27, A61P 7/00, C07C 275/26, 275/28,
335/12, 335/08, 275/34, 275/30, 271/22, 275/18, 275/20,
275/24, A61P 9/00, 13/00, 15/00, 19/00, 25/00, 27/00,
31/00, 33/00, 35/00, 43/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/02728

(22) Internationales Anmeldedatum:
13. März 2002 (13.03.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 18 550.2 14. April 2001 (14.04.2001) 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): **SCHADT, Oliver**
[DE/DE]; Eschenstrasse 22, 63517 Rodenbach (DE).
JONCZYK, Alfred [DE/DE]; Schepp Allee 57, 64295
Darmstadt (DE). **STÄHLE, Wolfgang** [DE/DE]; Neuweg
14c, 55218 Ingelheim (DE). **GOODMAN, Simon**
[DE/DE]; Friedrich-Ebert-Strasse 102a, 64347 Griesheim
(DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH**;
Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (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, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, 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, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

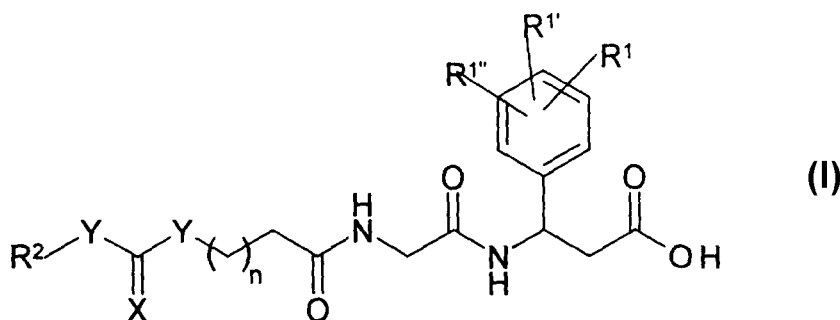
— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts: 9. Oktober 2003

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: LIGANDS DES INTEGRINS AVSS6

(54) Bezeichnung: LIGANDEN DES INTEGRINS ALPHA-V-BETA-6



(57) Abstract: The invention relates to the novel biphenyl derivatives of the general formula (I), wherein R^1 , $R^{1'}$, $R^{1''}$, R^2 and n are defined as in claim 1. The invention also relates to the stereoisomers and the physiologically acceptable salts or solvates thereof which represent novel integrin ligands, especially of the $\alpha_v\beta_6$ integrin receptor. The novel compounds are suitable for use as medicaments.

(57) Zusammenfassung: Neue Biphenyl-derivate der allgemeinen Formel (I) worin R^1 , $R^{1'}$, $R^{1''}$, R^2 und n die in Patentanspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, deren Stereoisomere und deren physiologisch unbedenklichen Salze oder Solvate sind neue Integrinliganden, insbesondere des $\alpha_v\beta_6$ -Integrinrezeptors. Die neuen Verbindungen können als Arzneimittel verwendet werden.



WO 02/083627 A3