(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
7. April 2005 (07.04.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/030728 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 217/24, 217/26, A61K 31/47, A61P 19/10

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/010248

(22) Internationales Anmeldedatum:
14. September 2004 (14.09.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 44 936.1 27. September 2003 (27.09.2003) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **AVENTIS PHARMA DEUTSCHLAND GMBH** [DE/DE]; Brüningstraße 50, 65929 Frankfurt (DE).

(72) Erfinder; und

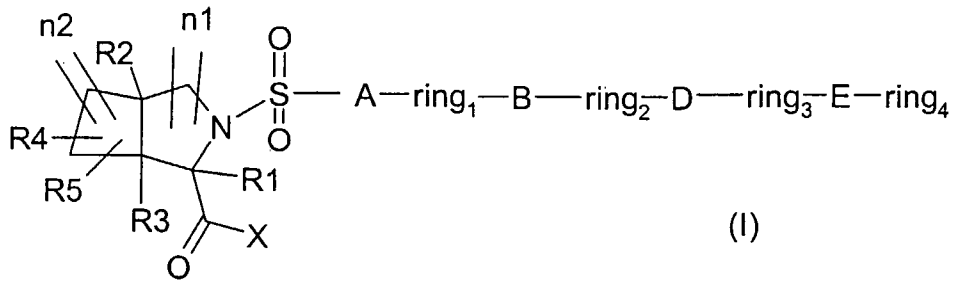
(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **SCHUDOK, Manfred** [DE/DE]; Eberlestrasse 28, 65817 Eppstein/Ts. (DE). **MATTER, Hans** [DE/DE]; Feldbergring 37, 63505 Langenselbold (DE). **HOFMEISTER, Armin** [DE/DE]; Pfaugasse 16, 55276 Oppenheim (DE).

(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, SY, TJ, TM,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: BICYCLIC IMINO ACID DERIVATIVES USED AS INHIBITORS OF MATRIX-METALLOPROTEINASES

(54) Bezeichnung: BICYCLISCHE IMINOSÄUREDERIVATE ALS INHIBITOREN VON MATRIX-METALLOPROTEINASEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I) which are suitable for the production of medicaments for the prophylaxis and therapy of diseases, whereby the course thereof involves the increased activity of matrix-metalloproteinases. Diseases belonging thereto are degenerative joint diseases, for example, osteo-arthrosis, spondylosis, chondroporosis after articulation injury or a long duration of articulation immobilisation after meniscus or patella injury or torn ligaments, or a disease of the connective tissue, such as collagenosis, periodontal diseases, problems with healing wounds, or a chronic disease of the locomotor system, such as inflammatory, immunological or metabolic-related acute or chronic arthritis, arthropathy, myalgies or troubles of the bone metabolism or ulceration, atherosclerosis or stenosis or an inflammatory disease or cancer, a metastatic tumour, cachexia, anorexia or septic shock.

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel (I) eignen sich zur Herstellung von Arzneimitteln zur Prophylaxe und Therapie von Erkrankungen,an deren Verlauf eine verstärkte Aktivität von Matrix-Metalloproteinasen beteiligt sind. Dazu gehören Erkrankungen wie eine degenerative Gelenkerkrankung beispielsweise Osteoarthrosen, Spondylosen, Knorpelschwund nach Gelenktrauma oder längerer Gelenksruhigstellung nach Meniskus- oder Patellaverletzungen oder Bänderrissen, oder eine Erkrankung des Bindegewebes wie Kollagenosen, Periodontalerkrankungen, Wundheilungsstörungen, oder eine chronische Erkrankung des Bewegungsapparates wie entzündliche, immunologisch oder stoffwechselbedingte akute oder chronische Arthritiden, Arthropathien, Myalgien oder Störungen des Knochenstoffwechsels oder eine Ulceration, Atherosklerose oder Stenose oder eine enzündliche Erkrankung oder eine Krebserkrankung, Tumormetastasenbildung, Kachexie, Anorexie oder septischer Schock.

WO 2005/030728 A1

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, IT, 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.