

(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

28. August 2014 (28.08.2014)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 2014/128067 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 401/10 (2006.01) A61P 31/12 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01) C07D 451/06 (2006.01)
C07D 405/10 (2006.01) C07D 471/10 (2006.01)
A61K 31/551 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01) C07D 487/08 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01) C07D 487/10 (2006.01)
A61P 7/00 (2006.01) C07D 491/048 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

10707 Berlin (DE). HAENDLER, Bernard; Am Biberbau 8, 13465 Berlin (DE). FERNÁNDEZ-MONTALVÁN, Amaury Ernesto; Kopenhagenerstr. 42, 10437 Berlin (DE). MÖNNING, Ursula; Eichendamm 5, 15569 Woltersdorf (DE). KRAUSE, Sabine; Heegermühler Weg 33, 13158 Berlin (DE). LEJEUNE, Pascale; Benekendorffstr. 85A, 13469 Berlin (DE). BUSEMANN, Matthias; Am Waldpark 20, 13467 Berlin (DE). KUHNKE, Joachim; Schulstr. 16, 14482 Potsdam (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2014/052984

(22) Internationales Anmeldedatum:
17. Februar 2014 (17.02.2014)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2013 202 678.1
19. Februar 2013 (19.02.2013) DE

(71) Anmelder: BAYER PHARMA
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Müllerstr. 178,
13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder: SIEGEL, Stephan; Aschaffenburg Str. 6,
10779 Berlin (DE). BÄURLE, Stefan; Fischzug 21H,
10245 Berlin (DE). CLEVE, Arwed; Konstanzer Str. 8,

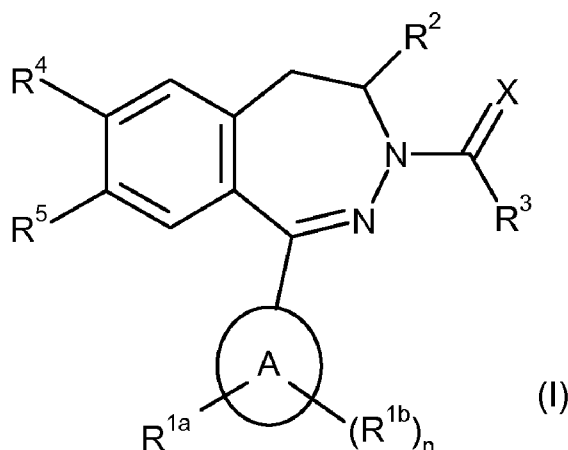
(74) Anwalt: BIP PATENTS; c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Creative Campus Monheim, Alfred-Nobel-Str. 10, 40789 Monheim am Rhein (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: BICYCLO 2,3-BENZODIAZEPINES AND SPIROCYCLICALLY SUBSTITUTED 2,3-BENZODIAZEPINES

(54) Bezeichnung : BICYCLO- UND SPIROCYCLISCH SUBSTITUIERTE 2,3-BENZODIAZEPINE



(57) Abstract: The invention relates to BET protein-inhibiting, in particular BRD4-inhibiting, bicyclo 2,3-benzodiazepines and spirocyclically substituted 2,3-benzodiazepines of the general formula (I), to the pharmaceutical agents containing the compounds according to the invention, and to the prophylactic and therapeutic use thereof against hyper-proliferative diseases, in particular tumor diseases. The invention further relates to the use of BET protein inhibitors in benign hyperplasia, atherosclerotic diseases, sepsis, autoimmune diseases, vascular disorders, viral infections, neurodegenerative disorders, inflammatory disorders, and male fertility control.

(57) Zusammenfassung: Es werden BET-proteininhibitorische, insbesondere BRD4-inhibitorische

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

WO 2014/128067 A1



(84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)

bicyclo- und spirocyclisch substituierte 2,3-Benzodiazepine der allgemeinen Formel (I), pharmazeutische Mittel enthaltend die erfindungsgemäßen Verbindungen sowie deren prophylaktische und therapeutische Verwendung bei hyper-proliferativen Erkrankungen, insbesondere bei Tumorerkrankungen beschrieben. Desweiteren wird die Verwendung von BET-Proteininhibitoren in benignen Hyperplasien, atherosklerotische Erkrankungen, Sepsis, Autoimmunerkrankungen, Gefäßerkrankungen, viralen Infektionen, in neurodegenerativen Erkrankungen, in inflammatorischen Erkrankungen, in atherosklerotischen Erkrankungen und in männlichen Fertilitätskontrolle beschrieben.