

(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 A2

(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

(74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH**;
Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(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

(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).

(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).

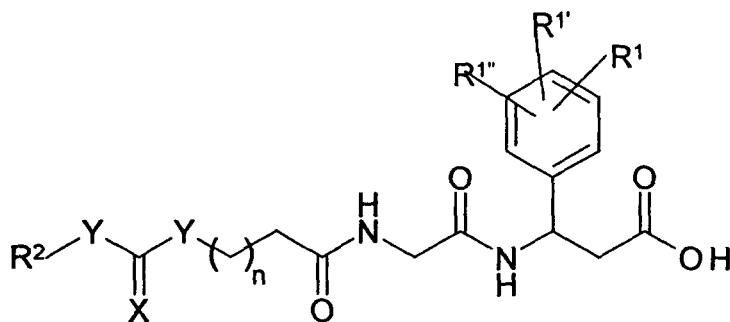
Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu
veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

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.

(54) Title: LIGANDS OF THE $\alpha_v\beta_6$ INTEGRIN

(54) Bezeichnung: LIGANDEN DES INTEGRINS $\alpha_v\beta_6$



(I)

(57) Abstract: The invention relates to the novel biphenyl derivatives of the general formula (I), wherein R¹, R^{1'}, R^{1''}, R² 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 R¹, R^{1'}, R^{1''}, R² 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 A2