

(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
8. November 2001 (08.11.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/83497 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07F 9/6574**,
A61K 31/665, A61P 3/10, C12P 9/00, C12N 1/20

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/04652

(22) Internationales Anmeldedatum:
25. April 2001 (25.04.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 21 731.1 4. Mai 2000 (04.05.2000) DE

(71) Anmelder: **AVENTIS PHARMA DEUTSCHLAND
GMBH** [DE/DE]; Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt
(DE).

(72) Erfinder: **VERTESY, Laszlo**; Eppenhainer Weg 6, 65817
Eppstein-Vockenhausen (DE). **EHRlich, Klaus**; Düs-
seldorfer Strasse 11, 65428 Rüsselsheim (DE). **KURZ,
Michael**; Erlenweg 7, 65719 Hofheim (DE). **WINK,
Joachim**; Magdeburger Strasse 14, 63322 Rödermark
(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, 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, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK,
SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, 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, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

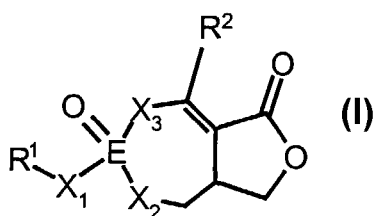
Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- 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.

(54) Title: CYCLIPOSTINS, A METHOD FOR THEIR PRODUCTION AND THE USE OF THE SAME

(54) Bezeichnung: CYCLIPOSTINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND VERWENDUNG DERSELBEN



(57) Abstract: The invention relates to compounds of the general formula (I), wherein R¹, R², E, X₁, X₂ and X₃ have the definitions in this application, obtained by the cultivation of the *Streptomyces* species HAG 004107 (DSM 13381) and to the physiologically compatible salts and chemical equivalents of said compounds. The invention also relates to a method for producing the cyclipostins and their physiologically compatible salts and chemical equivalents as medicaments, in particular as inhibitors of lipases, and to pharmaceutical preparations containing cyclipostin or a physiologically compatible salt or equivalent thereof.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft Verbindungen der allgemeinen Formel (I), worin R¹, R², E, X₁, X₂ und X₃ die Bedeutung hierin haben, erhältlich durch Kultivierung von *Streptomyces* species HAG 004107 (DSM 13381), und deren physiologisch verträglichen Salzen und chemischen Äquivalenten. Die Erfindung betrifft weiterhin ein Verfahren zur Herstellung der Cyclipostine, den Mikroorganismus HAG 004107 (DSM 13381), die Verwendung der Cyclipostine und deren physiologisch verträglichen Salze und chemischen Äquivalente als Arzneimittel, insbesondere als Inhibitoren von Lipasen, sowie pharmazeutische Zubereitungen mit einem Gehalt von Cyclipostin oder ein physiologisch verträgliches Salz oder Äquivalent davon.

WO 01/83497 A1