

(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
1. April 2004 (01.04.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/026881 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 513/08**,
515/08, 513/18, 487/08, 498/08, A61K 31/529, A61P
35/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/008664

(22) Internationales Anmeldedatum:
5. August 2003 (05.08.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 39 042.8 21. August 2002 (21.08.2002) DE

(71) Anmelder: **SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT**
[DE/DE]; Müllerstrasse 178, 13342 Berlin (DE).

(72) Erfinder: **LÜCKING, Ulrich**; Bergstrasse 62, 10115
Berlin (DE). **SIEMEISTER, Gerhard**; Reimerswalder
Steig 26, 13503 Berlin (DE). **SCHÄFER, Martina**;
Ossietzkystrasse 7, 13187 Berlin (DE). **BRIEM, Hans**;
Baumhauser Weg 41a, 28279 Bremen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, 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, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD,
SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ,
VC, 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, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

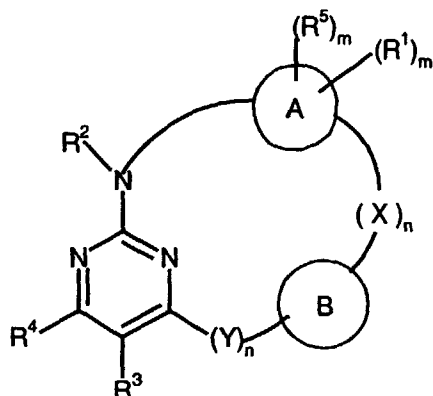
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: MACROCYCLIC PYRIMIDINES, THE PRODUCTION THEREOF AND THE USE OF THE SAME AS MEDICA-
MENTS

(54) Bezeichnung: MAKROZYKLISCHE PYRIMIDINE, DEREN HERSTELLUNG UND VERWENDUNG ALS ARZNEIMIT-
TEL



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to macrocyclic pyrimi-
dine derivatives of general formula (I) -wherein R¹ to R⁵, X, Y,
A, B, m and n have the designations cited in the description - as
inhibitors of the cyclin-dependent kinase. The invention also
relates to methods for producing said derivatives and to the use
of the same as medicaments for treating various illnesses.

(57) **Zusammenfassung:** Es werden makrozyklische Pyrimi-
dinderivate der allgemeinen Formel (I), in der R¹ bis R⁵, X,
Y, A, B, m und n die in der Beschreibung enthaltenen Bedeu-
tungen haben, als Inhibitoren der Zyklin-abhängigen Kinase,
deren Verfahren zur Herstellung sowie deren Verwendung als
Medikament zur Behandlung verschiedener Erkrankungen be-
schrieben.

WO 2004/026881 A1