2002047777

07 AUG 2002

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

162162

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
16. August 2001 (16.08.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/58893 A3

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 401/12, A61K 31/404, A61P 43/00, C07D 403/12, 417/14, 209/18

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/00084

(22) Internationales Anmeldedatum:
5. Januar 2001 (05.01.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 06 139.7 11. Februar 2000 (11.02.2000) DE

(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)*: **GOODMAN, Simon** [DE/DE]; Friedrich-Ebert Strasse 102a, 64347 Griesheim (DE). **GOTTSCHLICH, Rudolf** [DE/DE]; Buchenweg 1, 64354 Reinheim (DE). **WIESNER, Matthias** [—/DE]; Buchenweg 73, 55128 Mainz (DE).

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

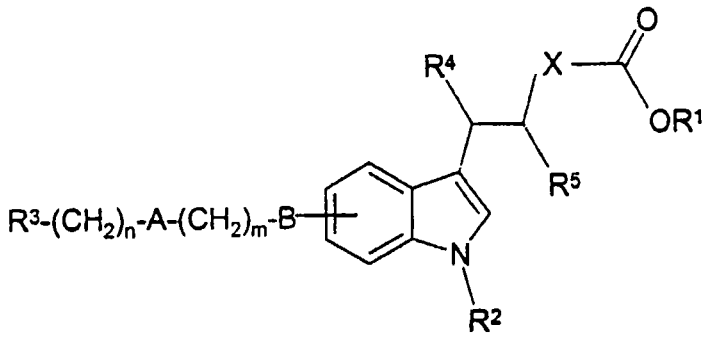
(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, 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).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) **Title:** INDOL-3-YL DERIVATIVES AND THEIR USE AS INTEGRIN INHIBITORS

(54) **Bezeichnung:** INDOL-3-YL-DERIVATE UND DEREN VERWENDUNG ALS INTEGRIN-INHIBITOREN



(I)

(57) **Abstract:** Indol-3-yl derivatives of general formula (I), wherein A, B, X, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, n or m have the meanings given in Claim 1, and the physiologically unobjectionable salts or solvates thereof are integrin inhibitors and can be used for combating thrombosis, myocardial infarcts, coronary heart diseases, arteriosclerosis, inflammations, tumours, osteoporosis, rheumatic arthritis, macular degenerative diseases, diabetic retinopathy, infections and restenosis after angioplasty or in the event of pathological actions which are maintained or propagated by angiogenesis.

(57) **Zusammenfassung:** Indol-3-yl-Derivate der allgemeinen Formel (I), worin A, B, X, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, n oder m die in Patentanspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze oder Solvate sind Integrininhibitoren und können zur Bekämpfung von Thrombosen, Herzinfarkt, koronaren Herzerkrankungen, Arteriosklerose, Entzündungen, Tumoren, Osteoporose, rheumatischer Arthritis, makularer degenerativer Krankheit, diabetischer Retinopathie, Infektionen und Restenose nach Angioplastie oder bei pathologischen Vorgängen, die durch Angiogenese unterhalten oder propagiert werden, eingesetzt werden.

WO 01/58893 A3

ACTION

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 18. April 2002

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.