(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. Februar 2002 (28.02.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/16323 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 213/74, 213/73, A61K 31/44, 31/4402, A61P 9/00, 35/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/08514

(22) Internationales Anmeldedatum:
24. Juli 2001 (24.07.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 41 428.1 23. August 2000 (23.08.2000) 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)*: **STAEHLE, Wolfgang** [DE/DE]; Neuweg 14c, 55218 Ingelheim (DE). **GOODMAN, Simon** [DE/DE]; Friedrich-Ebert-Strasse 102a, 64347 Griesheim (DE).

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

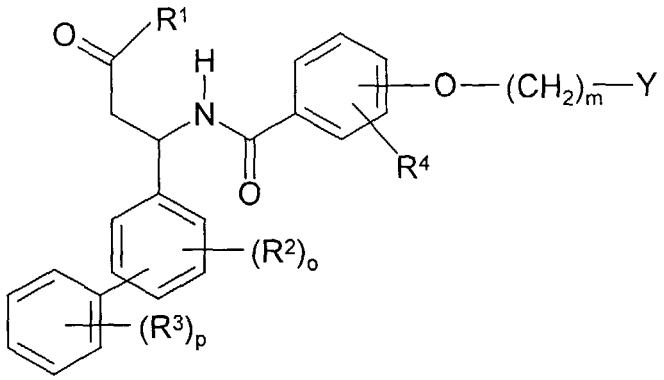
(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, 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, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) **Title:** BIPHENYL DERIVATIVES AND THE USE THEREOF AS INTEGRIN INHIBITORS

(54) **Bezeichnung:** BIPHENYLDERIVATE UND IHRE VERWENDUNG ALS INTIGRININHIBITOREN



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to novel biphenyl derivatives of general formula (I) wherein Y, R, R^1, R^2, R^3, R^4, m, o and p have the designation cited in patent claim 1; and the physiologically tolerable salts or solvates thereof. Said derivatives are integrin inhibitors and can be used to combat thrombosis, infarction, coronary heart disease, arteriosclerosis, inflammation, tumours, osteoporosis, infection and restenosis after angioplasty, or in pathological processes which are maintained or spread by angiogenesis.

(57) **Zusammenfassung:** Neue Biphenylderivate der allgemeinen Formel (I), worin Y, R, R^1, R^2, R^3, R^4, m, o und p 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, Infektionen und Restenose nach Angioplastie oder bei pathologischen Vorgängen, die durch Angiogenese unterhalten oder propagiert werden, eingesetzt werden.

WO 02/16323 A1

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.