(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
3. Februar 2005 (03.02.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/010030 A2

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07K 7/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/008057

(22) Internationales Anmeldedatum:
19. Juli 2004 (19.07.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
03016233.3 17. Juli 2003 (17.07.2003) EP

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **JERINI AG** [DE/DE]; Invalidenstrasse 130, 10115 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **HUMMEL, Gerd** [DE/DE]; Pankstrasse 12, 13357 Berlin (DE). **LOCARDI, Elsa** [DE/DE]; Wiclefstrasse 69, 10551 Berlin (DE). **POLAKOWSKI, Thomas** [DE/DE]; Dunckerstrasse 29a, 10439 Berlin (DE). **SCHARN, Dirk** [DE/DE]; Berliner Strasse 95, 13507 Berlin (DE). **SCHNATBAUM, Karsten** [DE/DE]; Seumestrasse 8, 10245 Berlin (DE).

(74) Anwalt: **BOHMANN, Armin, K.**; Bohmann & Loosen, Sonnenstrasse 8, 80331 München (DE).

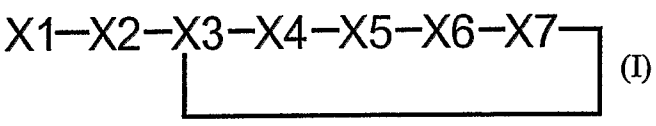
(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: C5A RECEPTOR ANTAGONISTS

(54) Bezeichnung: C5a-REZEPTOR-ANTAGONISTEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to a C5a receptor antagonist of structure (I), wherein X1 is a radical having a mass of about 1-300 and stands for R5-, R5-CO-, R5-N(R6)-CO-, R5-O-CO-, R5-SO_2-, R5-N(R6)-SO_2-, R5-N(R6)-, R5-N(R6)-CS-, R5-N(R6)-C(NH)-, R5-CS-, R5-P(O)OH-, R5-B(OH)- or R5-CH=N-O-CH_2-CO-, wherein R5/R6 represent H, F, hydroxy, alkyl, substituted alkyl, cycloalkyl, substituted cycloalkyl, heterocyclyl, substituted heterocyclyl, arylalkyl, substituted arylalkyl, aryl, substituted aryl, heteroaryl, substituted heteroaryl, acyl, substituted acyl, alkoxy, alkoxyalkyl, substituted alkoxyalkyl, aryloxyalkyl or substituted aryloxyalkyl; X2 = radical (biological bonding properties of a mimicrying phenylalanine unit); X3/X4 = spacer (amino acids, amino-acid analogs and amino-acid derivatives); X5 = radical (biological bonding properties of a mimicrying cyclohexylalanine or homoleucine unit); X6 = radical (biological bonding properties of a mimicrying tryptophan unit); X7 = radical (biological bonding properties of a mimicrying norleucine or phenylalanine unit), a chemical bond being formed between X3 and X7.

(57) Zusammenfassung: C5a-Rezeptor-Antagonist, der Struktur (I), wobei X1 ein Radikal mit einer Masse von etwa 1-300 ist und wobei X1 gleich R5-, R5-CO-, R5-N(R6)-CO-, R5-O-CO-, R5-SO_2-, R5-N(R6)-SO_2-, R5-N(R6)-, R5-N(R6)-CS-, R5-N(R6)-C(NH)-, R5-CS-, R5-P(O)OH-, R5-B(OH)-, oder R5-CH=N-O-CH_2-CO-, wobei R5 / R6 gleich H, F, Hydroxy, Alkyl, substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, substituiertes Cycloalkyl, Heterocyclyl, substituiertes Heterocyclyl, Arylalkyl, substituiertes Arylalkyl, Aryl, substituiertes Aryl, Heteroaryl, substituiertes Heteroaryl, Acyl, substituiertes Acyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, substituiertes Alkoxyalkyl, Aryloxyalkyl oder substituiertes Aryloxyalkyl, X2 = Radikal (biologische Bindungseigenschaften einer Phenylalanin-Einheit mimikrierend), X3 / X4 = Spacer (Aminosäuren, Aminosäure-Analoga und Aminosäure-Derivate), X5 = Radikal (biologische Bindungseigenschaften einer Cyclohexylalanin- oder Homoleucin-Einheit mimikrierend), X6 = Radikal (biologische Bindungseigenschaften einer Tryptophan-Einheit mimikrierend), X7 = Radikal (biologische Bindungseigenschaften einer Norleucin- oder Phenylalanin-Einheit mimikrierend), eine chemische Bindung zwischen X3 und X7 ausgebildet ist.

WO 2005/010030 A2

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.