

(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
4. März 2004 (04.03.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/018468 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 473/04**,
A61K 31/522, A61P 3/10

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/009127

(22) Internationales Anmeldedatum:
18. August 2003 (18.08.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 38 243.3 21. August 2002 (21.08.2002) DE
103 12 353.9 20. März 2003 (20.03.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH
& CO. KG** [DE/DE]; 55216 Ingelheim am Rhein (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **HIMMELSBACH,
Frank** [DE/DE]; Ahornweg 16, 88441 Mittelbiberach
(DE). **LANGKOPF, Elke** [DE/DE]; Schloss 3, 88447
Warthausen (DE). **ECKHARDT, Matthias** [DE/DE];
Kirschenweg 7, 88400 Biberach an der Riss (DE).
MARK, Michael [DE/DE]; Hugo-Haering-Strasse 50,
88400 Biberach an der Riss (DE). **MAIER, Roland**
[DE/DE]; Bodelschwingstr. 39, 88400 Biberach an der

Riss (DE). **LOTZ, Ralf, Richard, Hermann** [DE/DE];
Schluesslerstrasse 28, 88433 Schemmerhofen (DE). **TA-
DAYYON, Mohammad** [GB/DE]; Schülinstrasse 31,
89083 Ulm (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, 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, 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 (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).

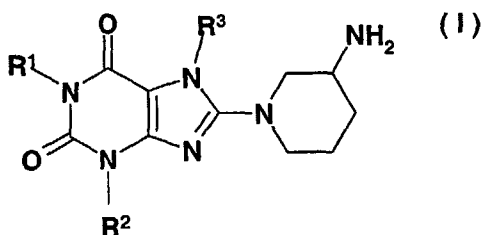
Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu ver-
öffentlichen nach Erhalt des Berichts

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: 8-[3-AMINO-PIPERIDIN-1-YL]-XANTHINES, THE PRODUCTION THEREOF AND THE USE OF THE SAME AS
MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: 8-[3-AMINO-PIPERIDIN-1-YL]-XANTHINE, DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG
ALS ARZNEIMITTEL



(57) Abstract: The invention relates to substituted xanthines of general formula (I) wherein R¹ to R³ have the designations cited in patent claims 1 to 16, and to the tautomers, stereoisomers, mixtures, prodrugs and salts thereof, which have precious pharmacological properties, especially an inhibiting effect on the activity of the enzyme dipeptidylpeptidase-IV (DPP-IV).

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Xanthine der allgemeinen Formel (I), in der R¹ bis R³ wie in den Ansprüchen 1 bis 16 definiert sind, deren Tautomere, deren Stereoisomere, deren Gemische, deren Prodrugs und deren Salze, welche wert-

volle pharmakologische Eigenschaften aufweisen, insbesondere eine Hemmwirkung auf die Aktivität des Enzyms Dipeptidylpeptidase-IV (DPP-IV).

WO 2004/018468 A2