(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
9. Oktober 2003 (09.10.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/082290 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: A61K 31/517, C07D 239/94, 405/12, 401/12, 413/12, 403/12, 498/08, 491/08, A61P 35/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/03062

(22) Internationales Anmeldedatum:
25. März 2003 (25.03.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 14 412.5 30. März 2002 (30.03.2002) DE
102 31 711.9 13. Juli 2002 (13.07.2002) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG** [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein (DE).

(72) Erfinder; und
(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **HIMMELSBACH, Frank** [DE/DE]; Ahornweg 16, 88441 Mittelbiberach (DE). **JUNG, Birgit** [DE/DE]; Schossäcker 9, 88471 Laupheim (DE). **SOLCA, Flavio** [CH/AT]; Gesslgasse 10/6, A-1230 Wien (AT).

(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, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

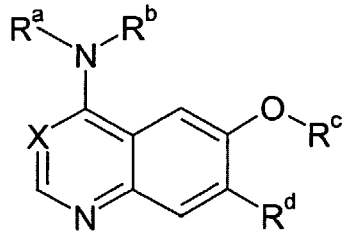
(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF,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

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

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.

(54) **Title:** 4-(N-PHENYLAMINO)-QUINAZOLINES / QUINOLINES AS TYROSINE KINASE INHIBITORS

(54) **Bezeichnung:** 4- (N-PHENYLAMINO) -CHINAZOLINE/CHINOLINE ALS TYROSINKINASEINHIBITOREN



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to the bicyclic heterocycles of the general formula (I), wherein R^a, R^b, R^c, R^d and X are defined as in claim 1, the tautomers, stereoisomers, mixtures and salts thereof, especially the physiologically acceptable salts thereof with inorganic or organic acids, which have valuable pharmacological properties, especially an inhibitory effect on tyrosine kinase-mediated signal transduction. The invention also relates to the use of the bicyclic heterocycles in the treatment of diseases, especially cancer diseases and of benign prostate hyperplasia (BPH), of diseases of the lung and the respiratory system, and further to the production of the bicyclic heterocycles.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung betrifft bicyclische Heterocyclen der allgemeinen Formel (I), in der R^a, R^b, R^c, R^d und X wie im Anspruch 1 definiert sind, deren Tautomere, deren Stereoisomere, deren Gemische und deren Salze, insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze mit anorganischen oder organischen Säuren, welche wertvolle pharmakologische Eigenschaften aufweisen, insbesondere eine Hemmwirkung auf die durch Tyrosinkinasen vermittelte Signaltransduktion, deren Verwendung zur Behandlung von Krankheiten, insbesondere von Tumorerkrankungen sowie der benignen Prostatahyperplasie (BPH), von Erkrankungen der Lunge und der Atemwege und deren Herstellung.

WO 03/082290 A1