20030216144

20 FEB 2003

(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
28. Februar 2002 (28.02.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/16328 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 235/30, 233/88, 233/48, A61K 31/4164, A61P 9/00, 35/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/08970

(22) Internationales Anmeldedatum:
2. August 2001 (02.08.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 41 423.0 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)*: **STÄHLE, Wolfgang** [DE/DE]; Neuweg 14c, 55218 Ingelheim (DE). **HÖLZEMANN, Günter** [DE/DE]; Gutenbergstrasse 6b, 64342 Seeheim-Jugenheim (DE). **GOODMAN, Simon** [GB/DE]; Friedrich-Ebert Strasse 102a, 64327 Griesheim (DE).

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

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, 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, 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.

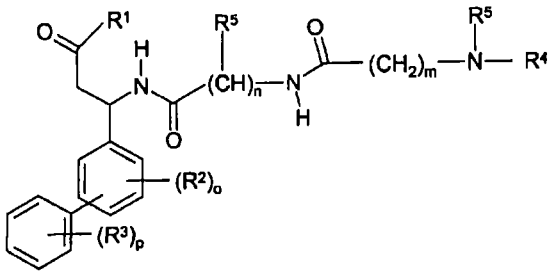
(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,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

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:** BIPHENYL DERIVATIVES AND THE USE THEREOF AS INTEGRIN INHIBITORS

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



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to novel biphenyl derivatives of the general formula (I), wherein R^4 represents an aromatic heterocycle, and to the physiologically acceptable salts or solvates thereof. The inventive compounds are integrin inhibitors and are used for combating thromboses, cardiac infarction, coronary heart diseases, arteriosclerosis, inflammations, tumors, osteoporosis, infections and restenosis following angioplasty or for pathological processes that are maintained or propagated by angiogenesis.

(57) **Zusammenfassung:** Neue Biphenylderivate der allgemeinen Formel (I) worin R^4 einen aromatischen Heterocyclus bedeutet, 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 02/16328 A1

ACTION