

(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. August 2012 (09.08.2012)

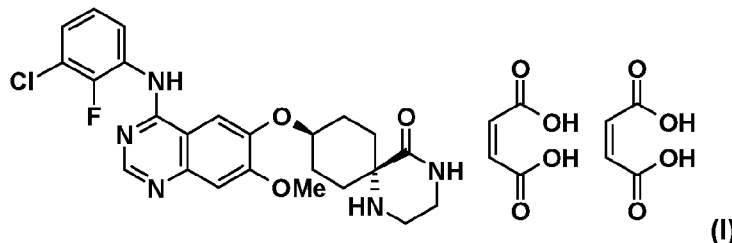


(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2012/104206 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation:
C07D 239/70 (2006.01) *A61K 31/517* (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) *A61P 11/00* (2006.01)
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2012/051298
- (22) Internationales Anmeldedatum:
27. Januar 2012 (27.01.2012)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
11152895.6 1. Februar 2011 (01.02.2011) EP
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH** [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **OSTERMEIER, Markus** [DE/DE]; Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE). **PFRENGLE, Waldemar** [DE/DE]; Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE). **HUCHLER, Guenther** [DE/DE]; Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE). **SIEGER, Peter** [DE/DE]; Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE).
- (74) Anwalt: **HAMMANN, Heinz**; c/o Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- Erklärungen gemäß Regel 4.17:
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

- (54) Title: 9-[4-(3-CHLOR-2-FLUOR-PHENYLAMINO)-7-METHOXY-QUINAZOLIN-6-YLOXY]-1,4-DIAZASPIRO[5.5]UNDECAN-5-ONE DIMALEATE, USE THEREOF AS A DRUG, AND PRODUCTION THEREOF
- (54) Bezeichnung : 9-[4-(3-CHLOR-2-FLUOR-PHENYLAMINO)-7-METHOXY-CHINAZOLIN-6-YLOXY]-1,4-DIAZASPIRO[5.5]UNDECAN-5-ON DIMALEAT, DESSEN VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL UND DESSEN HERSTELLUNG



(57) Abstract: The invention relates to a compound of formula (I), which has valuable pharmacological properties, in particular an inhibiting effect on the signal transduction mediated by tyrosine kinases, to methods for stereoselectively producing said compounds, in particular pharmaceutical formulations suitable for inhalation, and to the use thereof to treat illnesses, in particular tumor diseases, benign prostatic hyperplasia, and diseases of the lungs and respiratory tracts.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft eine Verbindung der Formel (I), welche wertvolle pharmakologische Eigenschaften aufweist, insbesondere eine Hemmwirkung auf die durch Tyrosinkinasen vermittelte Signaltransduktion, Verfahren zur stereoselektiven Herstellung dieser Verbindungen, insbesondere für die Inhalation geeignete pharmazeutische Formulierungen und deren Verwendung zur Behandlung von Krankheiten, insbesondere von Tumorerkrankungen, der benignen Prostatahyperplasie sowie von Erkrankungen der Lunge und der Atemwege.



Veröffentlicht:

- *mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)*