

(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
20. Juni 2002 (20.06.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/48099 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07C 317/32**,
C07D 213/75, 333/24, 233/64, C07C 323/52, C07D
209/20, 295/135, 401/04, C07C 275/42, 311/45, C07D
413/04, A61K 31/175, 31/4402, 31/381, 31/4172

BARNES, Christopher [GB/DE]; Alcestrasse 21, 65812
Bad Soden (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/13545

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

(22) Internationales Anmeldedatum:
21. November 2001 (21.11.2001)

(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, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG,
SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN,
YU, ZA, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 63 008.1 16. Dezember 2000 (16.12.2000) DE

(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, 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).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **MERCK PATENT GMBH** [DE/DE]; Frankfurter
Strasse, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **DORSCH, Dieter**
[DE/DE]; Königsberger Strasse 17a, 64372 Ober-Ramstadt
(DE). **MEDERSKI, Werner** [DE/DE]; Katzenellbogen-
weg 1, 64673 Zwingenberg (DE). **TSAKLAKIDIS,**
Christos [GR/DE]; Im Langgewann 54, 69469 Weinheim
(DE). **CEZANNE, Bertram** [DE/DE]; Goethestrasse 47,
64546 Mörfelden-Walldorf (DE). **GLEITZ, Johannes**
[DE/DE]; Liebigstrasse 26, 64283 Darmstadt (DE).

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: CARBOXYLIC ACID AMIDE DERIVATIVES AND THEIR USE IN THE TREATMENT OF THROMBOEMBOLIC DISEASES AND TUMOURS

(54) Bezeichnung: CARBONSÄUREAMIDDERIVATE UND IHRE VERWENDUNG IN DER BEHANDLUNG VON THROMBOEMBOLISCHEN ERKRANKUNGEN UND TUMOREN

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I), wherein the variables have the following meanings: D means a phenyl or a pyridyl which is unsubstituted or is mono- or polysubstituted by Hal, A, OR², N(R²)₂, NO₂, CN, COOR² or CON(R²)₂; R¹ means H, Ar, Het, cycloalkyl or A, which can be substituted by OR², SR², N(R²)₂, Ar, Het, cycloalkyl, CN, COOR² or CON(R²)₂; R² means H or A, E means phenylene which can be mono- or polysubstituted by Hal, A, OR², N(R²)₂, NO₂, CN, COOR² or CON(R²)₂ or piperidin-1,4-diyl, W means AR, Het or N(R²)₂ and if E=piperidin-1,4-diyl, also R₂ or cycloalkyl; and X means NH or O. These compounds are inhibitors of the coagulation factor Xa and can be used for the prevention and/or therapy of thromboembolic diseases and for treating tumours.

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel (I), worin die Variablen die folgende Bedeutung haben, D unsubstituiertes oder ein- oder mehrfach durch Hal, A, OR², N(R²)₂, NO₂, CN, COOR² oder CON(R²)₂ substituiertes Phenyl oder Pyridyl; R¹ H, Ar, Het, Cycloalkyl oder A, das durch OR², SR², N(R²)₂, Ar, Het, Cycloalkyl, CN, COOR² oder CON(R²)₂ substituiert sein kann; R² H oder A; E Phenylene, das ein- oder mehrfach durch Hal, A, OR², N(R²)₂, NO₂, CN, COOR² oder CON(R²)₂ substituiert sein kann oder Piperidin-1,4-diyl, W AR, Het oder N(R²)₂ und falls E=Piperidin-1, 4, diyl, auch R² oder Cycloalkyl, X NH oder O, sind Inhibitoren des Koagulationsfaktors Xa und können zur Prophylaxe und/oder Therapie von thromboembolischen Erkrankungen und zur Behandlung von Tumoren eingesetzt werden.

WO 02/48099 A1

