

(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. September 2005 (09.09.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/082895 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 403/12**,
235/14, 401/12, 413/12, 417/12, 413/14, 471/04, A61K
31/4184, 31/5377, 31/541, A61P 7/02

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/001796

(22) Internationales Anmeldedatum:
22. Februar 2005 (22.02.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 009 835.2
28. Februar 2004 (28.02.2004) DE
10 2004 060 984.5
18. Dezember 2004 (18.12.2004) DE

(71) Anmelder (nur für AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BE, BF, BG, BJ, BR, BW, BY, BZ, CA, CF, CG, CH, CI, CM, CN, CO, CR, CU, CY, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, FR, GA, GB, GD, GE, GH, GM, GN, GQ, GR, GW, HR, HU, ID, IE, IL, IN, IS, IT, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MC, MD, MG, MK, ML, MN, MR, MW, MX, MZ, NA, NE, NI, NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SI, SK): **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH** [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim (DE).

(71) Anmelder (nur für DE): **BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG** [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **GERLACH, Kai** [DE/DE]; Mondstrasse 18/1, 88400 Biberach (DE). **PFAU, Roland** [DE/DE]; Pfluggasse 15, 88400 Biberach (DE). **PRIEPKE, Henning** [DE/DE]; Birkenharderstr. 11, 88447 Warthausen (DE). **WIENEN, Wolfgang** [DE/DE]; Kirschenweg 27, 88400 Biberach (DE). **SCHULER-METZ, Annette, Maria** [DE/DE]; Holzgasse 7, 89081 Ulm (DE). **DAHMAN, Georg** [DE/DE]; Bahnhofstrasse 14, 88448 Attenweiler (DE). **NAR, Herbert** [DE/DE]; Hexenweg 19, 88416 Ochsenhausen (DE). **HANDSCHUH, Sandra, Ruth** [DE/DE]; Schustergasse 3, 88447 Warthausen (DE). **HAUEL, Norbert** [DE/DE]; Marderweg 12, 88433 Schemmerhofen (DE). **KAUFFMANN-HEFNER, Iris** [DE/DE]; Oelbachstrasse 10/1, 88448 Attenweiler (DE).

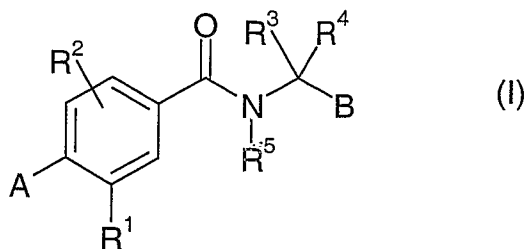
(74) Gemeinsamer Vertreter: **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH**; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: NOVEL CARBOXAMIDES FOR USE AS XA INHIBITORS

(54) Bezeichnung: NEUE CARBONSÄUREAMIDE ALS FAKTOR XA-INHIBITOREN



(57) Abstract: The invention relates to the novel substituted carboxamides of general formula (I), wherein A, B and R¹ to R⁵ are defined as in claim 1, the tautomers, enantiomers, diastereomers, mixtures and salts thereof, especially the physiologically salts thereof with inorganic or organic acids or bases, which have valuable properties. The inventive compounds have an antithrombotic effect and are factor Xa inhibitors.

(57) Zusammenfassung: Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind neue substituierte Carbonsäureamide der allgemeinen Formel (I), in der A, B und R¹ bis R⁵ wie in Anspruch 1 definiert sind, deren Tautomere, deren Enantiomere, deren Diastereomere, deren Gemische und deren Salze, insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze mit anorganischen oder organischen Säuren oder Basen, welche wertvolle Eigenschaften aufweisen. Die Verbindungen haben eine antithrombotische Wirkung und sind Faktor Xa-Inhibitoren.

WO 2005/082895 A1



CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, 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, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,

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.