

(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
28. April 2005 (28.04.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/037773 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07C 251/86**

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/010398

(22) Internationales Anmeldedatum:
16. September 2004 (16.09.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 46 913.3 9. Oktober 2003 (09.10.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **MERCK PATENT GMBH** [DE/DE]; Frankfurter
Str. 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **GERICKE, Rolf**
[DE/DE]; Mozartstrasse 19, 64342 Seeheim-Jugen-
heim (DE). **BEIER, Norbert** [DE/DE]; Maximil-
ian-Kolbe-Strasse 11, 64354 Reinheim (DE). **PÖSCHKE,**
Oliver [DE/DE]; Dahlienweg 25, 65201 Wiesbaden
(DE). **BURGDORF, Lars** [DE/DE]; Gabelsbergerstrasse
21, 60389 Frankfurt am Main (DE). **DROSDAT, Helga**
[DE/DE]; Im Vordersberg 12, 64646 Heppenheim (DE).
LANG, Florian [DE/DE]; Im Rotbad 52, 72076 Tübingen
(DE).

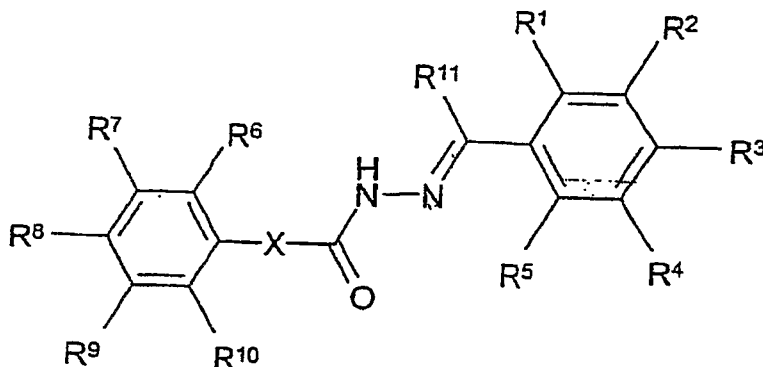
(74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH;**
Frankfurter Str. 250, 64293 Darmstadt (DE).

(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,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: ACYLHYDRAZONE DERIVATIVES AND THEIR USE IN THE INHIBITION, REGULATION AND/OR MODU-
LATION OF THE SIGNAL TRANSDUCTION OF KINASES

(54) Bezeichnung: ACYLHYDRAZONDERIVATE UND IHRE VERWENDUNG BEI DER HEMMUNG, REGULIERUNG
UND/ODER MODULATION DES SIGNALTRANSDUKTION VON KINASEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to acylhydrazone derivatives of formula (I), which are SGK inhibitors and can be used for the treatment of diseases and afflictions associated with SGK, such as diabetes, obesity, metabolic syndrome (dyslipidaemia), systematic and pulmonary hypertension, cardiovascular diseases and kidney diseases and in general for all types of fibroses and inflammatory processes. In said formula: R¹ and R⁵ independently of one another represent H, OH, OA, OAc or methyl; R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ and R¹⁰ independently of one another represent H, OH, OA, OAc, OCF₃, Hal, NO₂, CF₃, A, CN, OSO₂CH₃, SO₂CH₃, NH₂, or COOH; R¹¹ represents H or CH₃; A represents an alkyl comprising 1, 2, 3, or 4 C atoms; X represents CH₂, CH₂CH₂, OCH₂ or -CH(OH)- and Hal represents F, Cl, Br or I.

(57) Zusammenfassung: Acylhydrazonderivate der Formel (I) sind SGK-Inhibitoren und können zur Behandlung von SGK-be-
dingten Krankheiten und Leiden wie Diabetes, Fettleber, metabolisches Syndrom (Dyslipidämie), systematische und pulmonale
Hypertonie, Herz-Kreislauf-erkrankungen und Nierenerkrankungen, allgemein bei jeglicher Art von Fibrosen und entzündlichen Pro-
zessen verwendet werden. Worin R¹, R⁵ jeweils unabhängig voneinander H, OH, OA, OAc oder Methyl, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹,
R¹⁰ jeweils unabhängig voneinander H, OH, OA, OAc, OCF₃, Hal, NO₂, CF₃, A, CN, OSO₂CH₃, SO₂CH₃, NH₂ oder COOH, R¹¹ H
oder CH₃, A Alkyl mit 1, 2, 3 oder 4 C-Atomen X CH₂, CH₂CH₂, OCH₂ oder -CH(OH)-, Hal F, Cl, Br oder I.

WO 2005/037773 A1



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, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(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, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, 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
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

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.