(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
12. September 2003 (12.09.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/074512 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 401/12, 403/12, 217/12, A61P 35/04

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/01248

(22) Internationales Anmeldedatum:
7. Februar 2003 (07.02.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 09 692.9 6. März 2002 (06.03.2002) 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)*: **WIESNER, Matthias** [DE/DE]; Beethovenring 10, 64342 Seeheim-Jugenheim (DE). **GOODMAN, Simon** [GB/DE]; Friedrich-Ebert Strasse 102a, 64347 Griesheim (DE). **KESSLER, Horst** [DE/DE]; Friedrich-Stolzestrasse 250, 65824 Schwalbach (DE). **THUMSHIRN, Georgette** [DE/DE]; Elisabethstrasse 37, 80796 München (DE). **WEBER, Dirk** [DE/DE]; Kunigundenstrasse 53, 80805 München (DE). **GOTTSCHLING, Dirk** [DE/DE]; Wertachstrasse 31 d, 89250 Senden (DE).

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

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

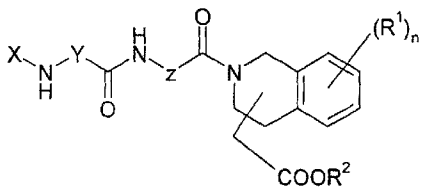
(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, 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:** ISOQUINOLINE DERIVATIVES

(54) **Bezeichnung:** ISOCHINOLINDERIVATE



(I)

(57) **Abstract:** Disclosed are isoquinoline derivatives of general formula (I), in which X, Y, Z, R^1, R^2, and n have the meanings indicated in claim (1), and the physiologically acceptable salts or solvates thereof, which are integrin inhibitors and can be used for the prevention of thromboses, heart attack, coronary heart diseases, arteriosclerosis, inflammations, tumors, osteoporosis, infections, and post-angioplasty restenosis or in pathological processes that are entertained or propagated by angiogenesis.

(57) **Zusammenfassung:** Isochinolinderivate der allgemeinen Formel (I), worin X, Y, Z, R^1, R^2 und n, die in Patentanspruch (1) angegebenen Bedeutungen haben, 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 03/074512 A1