

(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
19. Januar 2006 (19.01.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/005484 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 209/82**,
A61K 31/403, A61P 15/00, 35/00, 43/00

KÜHNE, Ronald [DE/DE]; Gleiwitzer Strasse 16, 12683
Berlin (DE). **SÖDERHÄLL, Arvid** [SE/DE]; Pestalozzi-
strasse 35, 13187 Berlin (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/007255

(74) **Anwalt: WIBBELMANN, Jobst**; WUESTHOFF &
WUESTHOFF, Schweigerstrasse 2, 81541 München (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:
5. Juli 2005 (05.07.2005)

(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,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA,
MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, 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.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) **Angaben zur Priorität:**
10 2004 033 902.3 14. Juli 2004 (14.07.2004) DE
60/587,969 14. Juli 2004 (14.07.2004) US
60/683,178 20. Mai 2005 (20.05.2005) US

(71) **Anmelder** (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **ZENTARIS GMBH** [DE/DE]; Weismüllerstrasse 45,
60314 Frankfurt/Main (DE). **SOLVAY PHARMACEU-
TICALS B.V.** [NL/NL]; C.J. van Houtenlaan 36, NL-1381
CP Weesp (NL).

(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, IS, IT, LT, LU, LV, 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).

(72) **Erfinder; und**

(75) **Erfinder/Anmelder** (nur für US): **PAULINI, Klaus**
[DE/DE]; In der Mainau 1, 63477 Maintal (DE). **GER-
LACH, Matthias** [DE/DE]; Pfarrgasse 1, 63636 Brachtal
(DE). **GÜNTHER, Eckhard** [DE/DE]; Wingertstrasse
176, 63477 Maintal (DE). **POLYMERPOULOS,
Emmanuel** [DE/DE]; Beethovenstrasse 60, 60325 Frank-
furt/Main (DE). **BAASNER, Silke** [DE/DE]; Dittersdorfer
Strasse 42, 61137 Schöneck (DE). **SCHMIDT, Peter**
[DE/DE]; Dittersdorfer Strasse 42, 61137 Schöneck (DE).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) **Title:** NOVEL TETRAHYDROCARBAZOLE DERIVATIVES WITH IMPROVED BIOLOGICAL ACTION AND
IMPROVED SOLUBILITY AS LIGANDS FOR G-PROTEIN COUPLED RECEPTORS (GPCRS)

(54) **Bezeichnung:** NEUE TETRAHYDROCARBAZOLDERIVAT MIT VERBESSERTER BIOLOGISCHER WIRKUNG
UND VERBESSERTER LÖSLICHKEIT ALS LIGANDEN FÜR G-PROTEIN GEKOPPELTE REZEPTOREN (GPCR'S)

(57) **Abstract:** The invention relates to novel tetrahydrocarbazole derivatives with improved properties, of application as inhibitors
of GPCRs. The possibility is thus provided for the treatment with the novel compounds of disease states the expression of which
depends on the pathological biochemical action of GPCRs. Said compounds have a particular antagonistic inhibition of the LHRH
receptor. The invention further relates to medicaments comprising one or more of the novel compounds as active ingredient. The
medicaments are particularly suitable for application in mammals and humans in oral dosage form.

(57) **Zusammenfassung:** Die vorliegende Erfindung stellt neue, in ihren Eigenschaften verbesserte Tetrahydrocarbazol-Derivate
bereit, die als Inhibitoren für GPCR's eingesetzt werden können. Damit ergibt sich die Möglichkeit, mit den neuen Verbindungen
Krankheitszustände zu behandeln, die in ihrer Ausprägung von der pathobiochemischen Wirkung von GPCR's abhängen. Insbeson-
dere wirken die erfindungsgemäßen Verbindungen über eine antagonistische Hemmung des LHRH-Rezeptors. Die Erfindung stellt
ferner Arzneimittel bereit, die eine oder mehrere der neuen Verbindungen als Wirkstoff enthalten. Die Arzneimittel sind insbeson-
dere geeignet, in einer oralen Darreichungsform am Säugetier oder Menschen eingesetzt zu werden.

WO 2006/005484 A1