

(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
14. Oktober 2004 (14.10.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/087696 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 413/12**,
401/12, 453/06, 403/12, C07C 275/26, A61K 31/5377,
31/4155, 31/4748, A61P 7/02

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

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/002407

(22) Internationales Anmeldedatum:
9. März 2004 (09.03.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(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, 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.

(30) Angaben zur Priorität:
103 15 377.2 3. April 2003 (03.04.2003) DE
103 29 295.0 30. Juni 2003 (30.06.2003) DE
103 36 570.2 8. August 2003 (08.08.2003) 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): **MEDERSKI, Werner**
[DE/DE]; Katzenelnbogenweg 1, 64673 Zwingenberg
(DE). **TSAKLAKIDIS, Christos** [GR/DE]; Im Lange-
wann 54, 69469 Weinheim (DE). **DORSCH, Dieter**
[DE/DE]; Königsberger Strasse 17 A, 64372 Ober-Ram-
stadt (DE). **CEZANNE, Bertram** [DE/DE]; Bahnstrasse
74, 64546 Mörfelden-Walldorf (DE). **GLEITZ, Johannes**
[DE/DE]; Liebigstrasse 26, 64293 Darmstadt (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, 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).

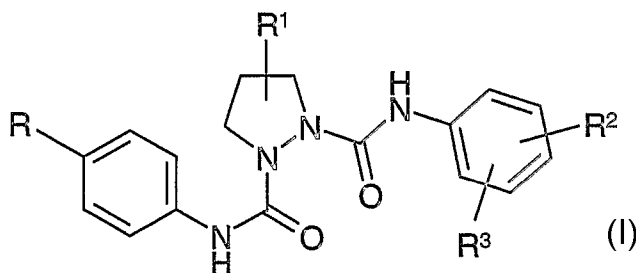
Veröffentlicht:

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

(54) Title: PYRAZOLIDINE-1,2-DICARBOXYLDIPHENYLAMIDE DERIVATIVES AS COAGULATION FACTOR XA IN-
HIBITORS FOR THE TREATMENT OF THROMBOSES

(54) Bezeichnung: PIRAZOLIDIN-1,2-DICARBONSAÜRE-1-((PHENYL)-AMID)-2-((PHENYL)-AMID) DERIVATE ALS
KOAGULATIONSFAKTOR XA INHIBITOREN ZUR BEHANDLUNG VON THROMBOSEN



(57) Abstract: The invention relates to novel compounds
of formula (I), where R, R¹, R² and R³ have the meanings
given in claim 1, which are inhibitors of coagulation factor
Xa and can be used for the prophylaxis and/or therapy of
thromboembolic diseases and for the treatment of tumours.

(57) Zusammenfassung: Neue Verbindungen der Formel
(I), worin R, R¹, R² und R³ die in Patentanspruch 1 angege-
bene Bedeutung haben, sind Inhibitoren des Koagulations-
faktors Xa und können zur Prophylaxe und/oder Therapie
von thromboembolischen Erkrankungen und zur Behand-

lung von Tumoren eingesetzt werden.

WO 2004/087696 A1