

9705281-5

RTMP
COPY



PCT
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6 : C07D 295/14, 211/58, 211/66, 471/10, 401/04, 401/12, 211/62, 211/64, 211/26, A61K 31/495, 31/445	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 96/32386 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 17. Oktober 1996 (17.10.96)		
<table border="0" style="width:100%;"> <tr> <td style="width:50%; vertical-align: top;"> (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP96/01548 (22) Internationales Anmeldedatum: 11. April 1996 (11.04.96) (30) Prioritätsdaten: 195 14 112.1 14. April 1995 (14.04.95) DE 195 19 245.1 25. Mai 1995 (25.05.95) DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BOEHRINGER INGELHEIM KG [DE/DE]; Postfach 200, D-55216 Ingelheim am Rhein (DE) (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHNORRENBERG, Gerd [DE/DE]; Ernst-Ludwig-Strasse 66a, D-55435 Gau-Algesheim (DE). DOLLINGER, Horst [DE/DE]; Kiefernstrasse 30c, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). ESSER, Franz [DE/DE]; Posener Strasse 30, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). BRIEM, Hans [DE/DE]; Im Gehren 9a, D-55257 Budenheim (DE). JUNG, Birgit [DE/DE]; Schlossbergstrasse 37, D-55411 Bingen (DE). SPECK, Georg [DE/DE]; In der Bitz 10, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). </td> <td style="width:50%; vertical-align: top;"> (81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, HU, JP, KR, KZ, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, UZ, VN, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i> </td> </tr> </table>			(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP96/01548 (22) Internationales Anmeldedatum: 11. April 1996 (11.04.96) (30) Prioritätsdaten: 195 14 112.1 14. April 1995 (14.04.95) DE 195 19 245.1 25. Mai 1995 (25.05.95) DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BOEHRINGER INGELHEIM KG [DE/DE]; Postfach 200, D-55216 Ingelheim am Rhein (DE) (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHNORRENBERG, Gerd [DE/DE]; Ernst-Ludwig-Strasse 66a, D-55435 Gau-Algesheim (DE). DOLLINGER, Horst [DE/DE]; Kiefernstrasse 30c, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). ESSER, Franz [DE/DE]; Posener Strasse 30, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). BRIEM, Hans [DE/DE]; Im Gehren 9a, D-55257 Budenheim (DE). JUNG, Birgit [DE/DE]; Schlossbergstrasse 37, D-55411 Bingen (DE). SPECK, Georg [DE/DE]; In der Bitz 10, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE).	(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, HU, JP, KR, KZ, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, UZ, VN, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i>
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP96/01548 (22) Internationales Anmeldedatum: 11. April 1996 (11.04.96) (30) Prioritätsdaten: 195 14 112.1 14. April 1995 (14.04.95) DE 195 19 245.1 25. Mai 1995 (25.05.95) DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BOEHRINGER INGELHEIM KG [DE/DE]; Postfach 200, D-55216 Ingelheim am Rhein (DE) (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SCHNORRENBERG, Gerd [DE/DE]; Ernst-Ludwig-Strasse 66a, D-55435 Gau-Algesheim (DE). DOLLINGER, Horst [DE/DE]; Kiefernstrasse 30c, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). ESSER, Franz [DE/DE]; Posener Strasse 30, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE). BRIEM, Hans [DE/DE]; Im Gehren 9a, D-55257 Budenheim (DE). JUNG, Birgit [DE/DE]; Schlossbergstrasse 37, D-55411 Bingen (DE). SPECK, Georg [DE/DE]; In der Bitz 10, D-55218 Ingelheim am Rhein (DE).	(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, HU, JP, KR, KZ, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, UZ, VN, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht <i>Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i>			
(54) Title: ARYL GLYCINAMIDE DERIVATIVES, METHODS OF PRODUCING THESE SUBSTANCES AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING SUCH COMPOUNDS (54) Bezeichnung: ARYLGLYCINAMIDDERIVATE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND DIESE VERBINDUNGEN ENTHALTENDE PHARMAZEUTISCHE ZUSAMMENSETZUNGEN (I) (II)				
(57) Abstract The invention concerns novel aryl glycinamide derivatives of general formula (I) and pharmaceutically acceptable salts thereof, the symbols having the following meanings: R¹ and R² together with the nitrogen atom to which they are bound form a ring of formula (II) shown in which p is 2 or 3 and X stands for oxygen, N(CH₂)_nR⁶ or CR⁷R⁸; and R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, Ar and n have the meanings indicated in the description. The invention also concerns the production and use of these substances. The novel compounds are valuable neurokinin (tachykinin) antagonists. (57) Zusammenfassung Die Erfindung betrifft neue Arylglycinamidderivate der allgemeinen Formel (I) und deren pharmazeutisch annehmbare Salze, worin R¹ und R² zusammen mit dem N, an den sie gebunden sind, einen Ring der Formel (II) bilden, worin p 2 oder 3 ist und X Sauerstoff, N(CH₂)_nR⁶ oder CR⁷R⁸ bedeutet, und R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, Ar und n die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen besitzen sowie deren Herstellung und Verwendung. Die neuen Verbindungen sind wertvolle Neurokinin (Tachykinin)-Antagonisten.				

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX	Mexiko
AT	Österreich	GE	Georgien	NE	Niger
AU	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BB	Barbados	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BF	Burkina Faso	IE	Irland	PL	Polen
BG	Bulgarien	IT	Italien	PT	Portugal
BJ	Benin	JP	Japan	RO	Rumänien
BR	Brasilien	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
BY	Belarus	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CG	Kongo	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
CH	Schweiz	LI	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LX	Litauen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
EE	Estland	MG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanien	ML	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	MN	Mongolei	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MR	Mauritanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	MW	Malawi		