(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
27. Januar 2005 (27.01.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/007157 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: A61K 31/4155, A61P 9/00, C07D 403/04, 409/14, 405/14, 401/14, 413/04, 417/04, 403/14, 401/04, 417/14, 413/14

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/007227

(22) Internationales Anmeldedatum:
2. Juli 2004 (02.07.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 31 951.4 15. Juli 2003 (15.07.2003) DE
10 2004 010 545 4. März 2004 (04.03.2004) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **BAYER HEALTHCARE AG** [DE/DE]; 51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **ALLERHEILIGEN, Swen** [DE/DE]; Beckumsfeld 4, 45259 Essen (DE). **BROHM, Dirk** [DE/DE]; Attenbergstr. 9, 58313 Herdecke (DE). **DIEDRICHS, Nicole** [DE/DE]; Laurentiusstr. 12, 42103 Wuppertal (DE). **FRÖHLEN, Britta-Nicole** [DE/DE]; Ophovener Str. 59, 51375 Leverkusen (DE). **GERDES, Christoph** [DE/DE]; Christian-Hess-Str. 81, 51373 Leverkusen (DE). **GNOTH, Mark, Jean** [DE/DE]; Am Hang 53, 40822 Mettmann (DE). **HECKROTH, Heike** [DE/DE]; August-Jung-Weg 34, 42113 Wuppertal (DE). **HÜBSCH, Walter** [DE/DE]; Wildsteig 22, 42113 Wuppertal (DE). **PERZBORN, Elisabeth** [DE/DE]; Am Tescher Busch 13, 42327 Wuppertal (DE). **STAHL, Elke** [DE/DE]; Reuterstr. 124, 51467 Bergisch Gladbach (DE). **VÖHRINGER, Verena** [DE/DE]; Am Hochsitz 17, 42113 Wuppertal (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER HEALTHCARE AG**; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

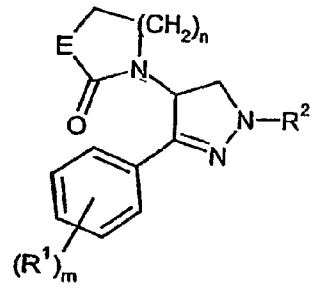
(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, 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,

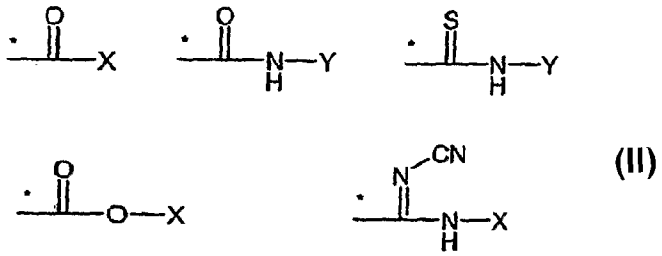
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: PYRAZOLINES AS PAR-1 ANTAGONISTS FOR TREATMENT OF CARDIOVASCULAR DISEASES

(54) Bezeichnung: PYRAZOLINE ALS PAR-1-ANTAGONISTEN ZUR BEHANDLUNG VON HERZ-KREISLAUF-ERKRANKUNGEN



(I)



(II)

(57) Abstract: The invention relates to pyrazolines of formula (I), where E = methylene, NH, O or S and R^2 = a group of formula (II), methods for the production and use thereof for the production of medicaments for the treatment and/or prophylaxis of diseases, in particular, cardiovascular diseases, such as thromboembolitic diseases.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft Pyrazoline der Formel (I) in welcher E für Methylen, NH, ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom steht, R^2 für eine Gruppe der Formel (II) steht, und Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krankheiten, insbesondere von Herz-Kreislauf-Erkrankungen, wie z.B. thromboembolischen Erkrankungen.

WO 2005/007157 A1

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).

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.

Veröffentlicht:

— *mit internationalem Recherchenbericht*