

(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  
10. März 2005 (10.03.2005)

PCT

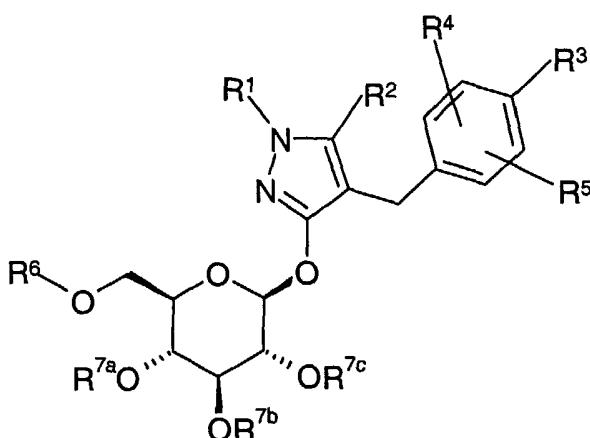
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2005/021566 A3**

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **C07H 17/02**, A61K 31/7056, A61P 3/10
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/009332
- (22) Internationales Anmeldedatum: 20. August 2004 (20.08.2004)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:  
10339549.0 26. August 2003 (26.08.2003) DE  
10359960.6 18. Dezember 2003 (18.12.2003) DE
- (71) Anmelder (nur für AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BE, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CY, CZ, 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, SZ, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW): **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH** [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 INGELHEIM (DE).
- (71) Anmelder (nur für DE): **BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA GMBH & CO. KG** [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 INGELHEIM (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **HIMMELSBACH, Frank** [DE/DE]; Ahornweg 16, 88441 MITTELBIBER-ACH (DE). **EICKELMANN, Peter** [DE/DE]; Schopenhauerstr. 6, 65191 WIESBADEN (DE). **THOMAS, Leo** [DE/DE]; Georg-Schinbain-Str. 221, 88400 BIBER-ACH (DE). **BARSOUMIAN, Edward Leon** [US/JP]; 2-6-18-801 Nishi-Midorigaoka, TOYONAKA, Osaka 560-0005 (JP).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH**; Binger Strasse 173, 55216 INGELHEIM (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, SZ, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW)

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: GLUCOPYRANOSYLOXY-PIRAZOLES, DRUGS CONTAINING SAID COMPOUNDS THE USE AND PRODUCTION METHOD THEREOF

(54) Bezeichnung: GLUCOPYRANOSYLOXY-PYRAZOLE, DIESE VERBINDUNGEN ENTHALTENDE ARZNEIMITTEL, DEREN VERWENDUNG UND VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG



WO 2005/021566 A3

R7b, R7c im Anspruch 1 definiert sind, deren Tautomere, deren Stereoisomere, deren Gemische und deren Salze, insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze mit anorganischen oder organischen Säuren, welche wertvolle pharmakologische Eigenschaften aufweisen, insbesondere eine Hemmwirkung auf den natriumabhängigen Glucose-Cotransporter SGLT, deren Verwendung zur Behandlung von Krankheiten, insbesondere von Stoffwechselerkrankungen wie Diabetes und deren Herstellung.

(57) Abstract: The invention relates to glucopyranosyloxy-pirazoles of formula (I), wherein R<sup>1</sup> to R<sup>6</sup> and R<sup>7a</sup>, R<sup>7b</sup> and R<sup>7c</sup> are defined in the claim 1, to the tautomers, stereoisomers, mixtures and the salts thereof, in particular the salts which are physiologically compatible with inorganic or organic acids and exhibit interesting pharmacological properties, in particular inhibitor effect on a sodium-dependent SGLT glucose cotransporter. The use of the inventive compounds for treating diseases, in particular metabolic diseases such as diabetes and the production thereof are also disclosed.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Glucopyranosyloxy-pyrazole der allgemeinen Formel (I), in der R1 bis R6 sowie R7a, R7b, R7c im Anspruch 1 definiert sind, deren Tautomere, deren Stereoisomere, deren Gemische und deren Salze, insbesondere deren physiologisch verträgliche Salze mit anorganischen oder organischen Säuren, welche wertvolle pharmakologische Eigenschaften aufweisen, insbesondere eine Hemmwirkung auf den natriumabhängigen Glucose-Cotransporter SGLT, deren Verwendung zur Behandlung von Krankheiten, insbesondere von Stoffwechselerkrankungen wie Diabetes und deren Herstellung.



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, 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).

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

- (88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:**

7. April 2005

*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.*

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/009332

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
 IPC 7 C07H17/02 A61K31/7056 A61P3/10

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07H A61K A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 02/068439 A (KISSEI PHARMACEUTICAL ; NISHIMURA TOSHIHIRO (JP); KATSUNO KENJI (JP);) 6 September 2002 (2002-09-06) cited in the application claim 1; example 31 & EP 1 364 957 A (KISSEI PHARMACEUTICAL) 26 November 2003 (2003-11-26) -----	1-3,5-16
A	WO 02/053573 A (KISSEI PHARMACEUTICAL ; NAKABAYASHI TAKESHI (JP); NISHIMURA TOSHIHIRO) 11 July 2002 (2002-07-11) cited in the application & EP 1 354 888 A (KISSEI PHARMACEUTICAL) 22 October 2003 (2003-10-22) -----	
A	WO 02/068440 A (KISSEI PHARMACEUTICAL ; NISHIMURA TOSHIHIRO (JP); KATSUNO KENJI (JP);) 6 September 2002 (2002-09-06) cited in the application -----	-/-

 Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*&\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report.
3 February 2005	15.02.05
Name and mailing address of the ISA  European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer  Bardili, W

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/009332

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	& EP 1 364 958 A (KISSEI PHARMACEUTICAL) 26 November 2003 (2003-11-26)  WO 02/088157 A (AJINOMOTO CO., INC; OHSUMI, KOJI; MATSUEDA, HIROYUKI; HATANAKA, TOSHIH) 7 November 2002 (2002-11-07)	

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

EP2004/009332

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2.  Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
  
3.  Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

**SEE SUPPLEMENTAL SHEET**

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

**Remark on Protest**

The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.



No protest accompanied the payment of additional search fees.

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, namely

1. Claims 1, 2, 3, 5, 6-16 (in part in each case), 4 (in full)

- (i) compounds of general formula (I) wherein R<sup>1</sup> represents alkynyl (p. 65, line 3),
- (ii) compounds of general formula (I) wherein R<sup>1</sup> contains one of the heterocycles THF, THP, pyrrolidine or piperidine (page 65, lines 3-10),
- (iii) compounds of general formula (I) wherein R<sup>1</sup> represents hydrogen, optionally substituted alkyl, alkenyl, cycloalkyl or aryl (page 66, lines 1-4) and R<sup>3</sup> contains one of the heterocycles THF, THP, pyrrolidine or piperidine (page 65, lines 11-12 in conjunction with page 67, lines 4-12) as well as preparation and use thereof.

---

2. Claims 1, 2, 6-16 (in part in each case)

- (iv) compounds of general formula (I) wherein R<sup>1</sup> represents hydrogen, optionally substituted alkyl, alkenyl, cycloalkyl or aryl (page 66, lines 1-4) and R<sup>3</sup> together with R<sup>4</sup> are as specified in sections (b) and (c) of the claim (page 65, lines 13-16) as well as preparation and use thereof.

---

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/009332

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
WO 02068439	A	06-09-2002	CA EP WO TW US	2438593 A1 1364957 A1 02068439 A1 593329 B 2004132669 A1	06-09-2002 26-11-2003 06-09-2002 21-06-2004 08-07-2004
EP 1364957	A	26-11-2003	CA EP US WO TW	2438593 A1 1364957 A1 2004132669 A1 02068439 A1 593329 B	06-09-2002 26-11-2003 08-07-2004 06-09-2002 21-06-2004
WO 02053573	A	11-07-2002	BR CA CZ EP HU WO NO SK US	0116607 A 2432145 A1 20031753 A3 1354888 A1 0302550 A2 02053573 A1 20032909 A 8092003 A3 2004063646 A1	20-04-2004 11-07-2002 15-10-2003 22-10-2003 28-11-2003 11-07-2002 27-08-2003 08-01-2004 01-04-2004
EP 1354888	A	22-10-2003	BR CA EP HU NO SK US CZ WO	0116607 A 2432145 A1 1354888 A1 0302550 A2 20032909 A 8092003 A3 2004063646 A1 20031753 A3 02053573 A1	20-04-2004 11-07-2002 22-10-2003 28-11-2003 27-08-2003 08-01-2004 01-04-2004 15-10-2003 11-07-2002
WO 02068440	A	06-09-2002	CA EP WO US	2438595 A1 1364958 A1 02068440 A1 2004116357 A1	06-09-2002 26-11-2003 06-09-2002 17-06-2004
EP 1364958	A	26-11-2003	CA EP US WO	2438595 A1 1364958 A1 2004116357 A1 02068440 A1	06-09-2002 26-11-2003 17-06-2004 06-09-2002
WO 02088157	A	07-11-2002	CA EP WO US	2445346 A1 1389621 A1 02088157 A1 2004110936 A1	07-11-2002 18-02-2004 07-11-2002 10-06-2004

**INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/009332

**A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
IPK 7 C07H17/02 A61K31/7056 A61P3/10

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 7 C07H A61K A61P

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie <sup>a</sup>	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 02/068439 A (KISSEI PHARMACEUTICAL ; NISHIMURA TOSHIHIRO (JP); KATSUNO KENJI (JP);) 6. September 2002 (2002-09-06) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1; Beispiel 31 & EP 1 364 957 A (KISSEI PHARMACEUTICAL) 26. November 2003 (2003-11-26) ----	1-3,5-16
A	WO 02/053573 A (KISSEI PHARMACEUTICAL ; NAKABAYASHI TAKESHI (JP); NISHIMURA TOSHIHIRO) 11. Juli 2002 (2002-07-11) in der Anmeldung erwähnt & EP 1 354 888 A (KISSEI PHARMACEUTICAL) 22. Oktober 2003 (2003-10-22) ----	
A	WO 02/068440 A (KISSEI PHARMACEUTICAL ; NISHIMURA TOSHIHIRO (JP); KATSUNO KENJI (JP);) 6. September 2002 (2002-09-06) in der Anmeldung erwähnt ----	-/-



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

- Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
  - \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
  - \*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
  - \*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
  - \*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
  - \*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- \*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*&\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
3. Februar 2005	15.02.05
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter  Bardili, W

**INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/009332

**C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	& EP 1 364 958 A (KISSEI PHARMACEUTICAL) 26. November 2003 (2003-11-26)  WO 02/088157 A (AJINOMOTO CO., INC; OHSUMI, KOJI; MATSUEDA, HIROYUKI; HATANAKA, TOSHIH) 7. November 2002 (2002-11-07) -----	

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

**Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)**

Gemäß Artikel 17(2)(a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1.  Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
  
2.  Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
  
3.  Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

**Feld III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)**

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1.  Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
  
2.  Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
  
3.  Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
  
4.  Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

**Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs**

Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.

Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1, 2, 3, 5, 6-16 (jeweils Teil), 4 (vollständig)

- (i) Verbindungen der allgemeinen Formel (I), wobei R1 Alkinyl repräsentiert (S. 65, Z. 3)
- (ii) Verbindungen der allgemeinen Formel (I), wobei R1 einen der Heterozyklen THF, THP, Pyrrolidin oder Piperidin enthält (S. 65, Z. 3-10)
- (iii) Verbindungen der allgemeinen Formel (I), wobei R1 Wasserstoff, ggf. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl oder Aryl repräsentiert (S. 66, Z. 1-4) und R3 einen der Heterozyklen THF, THP, Pyrrolidin oder Piperidin enthält (S. 65, Z. 11-12 in Verbindung mit S. 67, Z. 4-12) sowie deren Herstellung und Verwendung.

---

2. Ansprüche: 1, 2, 6-16 (jeweils Teil)

- (iv) Verbindungen der allgemeinen Formel (I), wobei R1 Wasserstoff, ggf. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Cycloalkyl oder Aryl repräsentiert (S. 66, Z. 1-4) und R3 zusammen mit R4 die in den Abschnitten (b) und (c) des Anspruches angegebenen speziellen Bedeutungen haben (S. 65, Z. 13-16) sowie deren Herstellung und Verwendung.

---

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/009332

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 02068439	A	06-09-2002	CA	2438593 A1		06-09-2002
			EP	1364957 A1		26-11-2003
			WO	02068439 A1		06-09-2002
			TW	593329 B		21-06-2004
			US	2004132669 A1		08-07-2004
EP 1364957	A	26-11-2003	CA	2438593 A1		06-09-2002
			EP	1364957 A1		26-11-2003
			US	2004132669 A1		08-07-2004
			WO	02068439 A1		06-09-2002
			TW	593329 B		21-06-2004
WO 02053573	A	11-07-2002	BR	0116607 A		20-04-2004
			CA	2432145 A1		11-07-2002
			CZ	20031753 A3		15-10-2003
			EP	1354888 A1		22-10-2003
			HU	0302550 A2		28-11-2003
			WO	02053573 A1		11-07-2002
			NO	20032909 A		27-08-2003
			SK	8092003 A3		08-01-2004
			US	2004063646 A1		01-04-2004
EP 1354888	A	22-10-2003	BR	0116607 A		20-04-2004
			CA	2432145 A1		11-07-2002
			EP	1354888 A1		22-10-2003
			HU	0302550 A2		28-11-2003
			NO	20032909 A		27-08-2003
			SK	8092003 A3		08-01-2004
			US	2004063646 A1		01-04-2004
			CZ	20031753 A3		15-10-2003
			WO	02053573 A1		11-07-2002
WO 02068440	A	06-09-2002	CA	2438595 A1		06-09-2002
			EP	1364958 A1		26-11-2003
			WO	02068440 A1		06-09-2002
			US	2004116357 A1		17-06-2004
EP 1364958	A	26-11-2003	CA	2438595 A1		06-09-2002
			EP	1364958 A1		26-11-2003
			US	2004116357 A1		17-06-2004
			WO	02068440 A1		06-09-2002
WO 02088157	A	07-11-2002	CA	2445346 A1		07-11-2002
			EP	1389621 A1		18-02-2004
			WO	02088157 A1		07-11-2002
			US	2004110936 A1		10-06-2004