

SCHWEIZERISCHE Eidgenossenschaft
EIDGENÖSSISCHES INSTITUT FÜR GEISTIGES EIGENTUM

(11) **CH/EP 1 175 401 H1**

(19)

Erfindungspatent für die Schweiz und Liechtenstein

Schweizerisch-liechtensteinischer Patentschutzvertrag vom 22. Dezember 1978

(51) Int. Cl.: **C07D 211/58** (2006.01)
C07D 401/06 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 401/10 (2006.01)
C07D 413/06 (2006.01)
C07D 409/06 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)

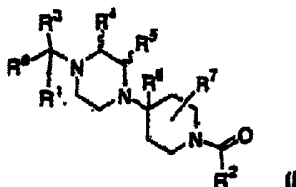
(12) **TEILVERZICHT**

(21) Gesuchsnummer:	926486.2	(73) Inhaber:	Shering Corporation, 2000 Galloping Hill Road US-Kenilworth, New Jersey 07033-0530 (US)
(22) Anmeldedatum:	01.05.2000	(72) Erfinder:	Baroudy Bahige, M. Westfield, NJ 07090 (US) Clader John, W. Cranford, NJ 07016 (US) Josien Hubert, B. Hoboken, NJ 07030 (US) McCombie Stuart, W. Caldwell, NJ 07006 (US) McKittrick Brian, A. Bloomfield, NJ 07003 (US) Miller Michael, W. Westfield, NJ 07090 (US) Neustadt Bernard, R. West Orange, NJ 07052 (US) Palani Anandan, Bridgewater, NJ 08807 (US) Smith Elizabeth, M. Verona, NJ 07044 (US) Steensma, Ruo Weehawken, NJ 07087 (US) Tagat Jayaram, R. Westfield, NJ 07090 (US) Vice Susan, F. Mountainside, NJ 07092 (US) Laughlin Mark, A. Edison, NJ 08820 (US) Gilbert Eric, Scotch Plains, NJ 07076 (US) Labroli Marc, A. Mount Laurel, NJ 08054 (US)
(30) Priorität:	04.05.1999 US 305266	(74) Vertreter:	E. Blum & Co. Patentanwälte, Am Vorderberg 11 8044 Zürich (CH)
(24) Patent erteilt:	20.07.2005	(86) Internationale Anmeldung:	PCT/US 2000/011632
(45) Patentschrift veröffentlicht:	30.01.2002	(87) Internationale Veröffentlichung:	WO 200/066558
(23) Verzichtserklärung eingereicht:	21.11.2006		
(40) Verzichtserklärung veröffentlicht:	15.02.2007		

In Anwendung von Art. 24 Abs. 1 Bst. c des Bundesgesetzes über die Erfindungspatente PatG verzichtet der Inhaber des Patents EP 1 175 401 teilweise auf das Patent, in dem Sinne, dass

I. der bisherige unabhängige Patentanspruch 1 durch das Weglassen der Alternative (2) die folgende eingeschränkte Fassung erhält:

Verbindung mit der Strukturformel II

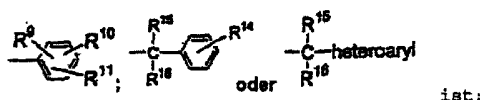


oder ein pharmazeutisch annehmbares Salz davon; worin (1) R^a R^{8a}-Phenyl, R^{8b}-Pyridyl, R^{8b}-Thiophenyl oder R⁸-Naphthyl ist;

R¹ Wasserstoff oder (C₁-C₆)-Alkyl ist;

R² 6-gliedriges Heteroaryl, das mit R⁹, R¹⁰ und R¹¹ substituiert ist; 6-gliedriges Heteroaryl-N-oxid, das mit R⁹, R¹⁰ und R¹¹ substituiert ist; 5-gliedriges Heteroaryl, das mit R¹² und R¹³ substituiert ist; Naphthyl; Fluorenyl; Diphenylmethyl;

CH/EP 1 175 401 H1



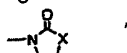
R³ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, (C₁-C₆)-Alkoxy(C₁-C₆)alkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkyl(C₁-C₆)alkyl, R⁸-Phenyl, R⁸-Phenyl(C₁-C₆)alkyl, R⁸-Naphthyl, R⁸-Naphthyl(C₁-C₆)alkyl, R⁸-Heteroaryl oder R⁸-Heteroaryl(C₁-C₆)alkyl ist;
 R⁴, R⁵, R⁷ und R¹³ unabhängig ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff und (C₁-C₆) -Alkyl;
 R⁶ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl oder C₂-C₆-Alkenyl ist;
 R⁸ 1 bis 3 Substituenten ist, die unabhängig ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff-, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, -CF₃, CF₃O-, CH₃C(O)-, -CN, CH₃SO₂-, CF₃SO₂-, R¹⁴-Phenyl, R¹⁴-Benzyl, CH₃C (=NOCH₃), CH₃C (-NOCH₂CH₃),

, NH₂, -NHCOCF₃, -NHCONH (C₁-C₆-alkyl), -NHCO (C₁-C₆-alkyl), -NHSO₂ (C₁-C₆-alkyl), 5-gliedrigem Heteroaryl und



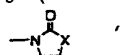
wobei X -O-, -NH- oder -N(CH₃)- ist;

R^{8a} 1 bis 3 Substituenten ist, die unabhängig ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, Halogen, -CF₃, CF₃O-, -CN, CF₃SO₂-, R¹⁴-Phenyl, -NHCOCF₃, 5-gliedrigem Heteroaryl und



worin X wie oben definiert ist;

R^{8b} 1 bis 3 Substituenten ist, die unabhängig ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, Halogen, -CF₃, CF₃O-, CH₃C(O)-, -CN, CF₃SO₂-, CH₃C (=NOCH₃), CH₃C (=NOCH₂CH₃), -NHCOCF₃, 5-gliedrigem Heteroaryl und



worin X wie oben definiert ist;

R⁹ und R¹⁰ unabhängig ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus (C₁-C₆)-Alkyl, Halogen, -NR¹⁷R¹⁸, -OH, -CF₃, -OCH₃, -O-Acyl, -OCF₃ und -Si(CH₃)₃;

R¹¹ R⁹, Wasserstoff, Phenyl, -NO₂, -CN, -CH₂F, -CHF₂, -CHO, -CH=NOR¹⁷, Pyridyl, Pyridyl N-oxid, Pyrimidinyl, Pyrazinyl, -N(R¹⁷) CONR¹⁸R¹⁹, -NHCONH (chlor-(C₁-C₆)alkyl), NHCONH₃ (C₃-C₁₀-cycloalkyl (C₁-C₆alkyl)), -NHCO(C₁-C₆)alkyl, -NHCOCF₃, -NHSO₂N((C₁-C₆)alkyl)₂, -NHSO₂ (C₁-C₆)alkyl, -N(SO₂CF₃)₂, -NHCO₂(C₁-C₆)alkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkyl, -SR²⁰, -SOR²⁰, -SO₂R²⁰, -SO₂NH(C₁-C₆-alkyl), -OSO₂(C₁-C₆)alkyl, -OSO₂CF₃, Hydroxy(C₁-C₆)alkyl, -CONR¹⁷R¹⁸, -CON(CH₂CH₂-O-CH₃)₂, -OCONH(C₁-C₆)alkyl, -CO₂R¹⁷, -Si(CH₃)₃ oder -B(OC(CH₃)₂)₂ ist;

R¹²(C₁-C₆) -Alkyl, -NH₂ oder R¹⁴-Phenyl ist;

R¹⁴ 1 bis 3 Substituenten ist, die unabhängig ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, -CF₃, -CO₂R¹⁷, -CN, (C₁-C₆)-Alkoxy und Halogen;

R¹⁵ und R¹⁶ unabhängig ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus Wasserstoff und C₁-C₆-Alkyl, oder R¹⁵ und R¹⁶ zusammen eine C₂-C₅-Akylengruppe sind und mit dem Kohlenstoff, an den sie gebunden sind, einen Spiroring mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen bilden:

R¹⁷, R¹⁸ und R¹⁹ unabhängig ausgewählt sind aus der Gruppe bestehend aus H und C₁-C₆-Alkyl; und

R²⁰ C₁-C₆-Alkyl oder Phenyl ist.

II. alle weiteren Ansprüche in ihrer ursprünglichen Fassung beibehalten werden.

Soweit Teile der Beschreibung und Zeichnungen mit der Neuordnung des Patentanspruchs und der abhängigen Ansprüche nicht vereinbar sind, sollen sie als nicht vorhanden gelten.