

(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
15. Dezember 2005 (15.12.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/118558 A3

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 401/12 (2006.01) A61K 31/506 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01) A61P 25/36 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)

(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, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/006000

(22) Internationales Anmeldedatum:
3. Juni 2005 (03.06.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2004 027 358.8 4. Juni 2004 (04.06.2004) DE

(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, IS, IT, LT, 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).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): ABBOTT GMBH & CO. KG [DE/DE]; Max-Planck-Ring 2, 65205 Wiesbaden (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GENESTE, Hervé [FR/DE]; Rehbachstr. 42, 67141 Neuhofen (DE). HAUPT, Andreas [DE/DE]; Schaelzigweg 52, 68723 Schwetzingen (DE). BRAJE, Wilfried [DE/DE]; Meerfeldstr. 52, 68163 Mannheim (DE). LUBISCH, Wilfried [DE/DE]; Haeusserstrasse 15, 69115 Heidelberg (DE). STEINER, Gerd [DE/DE]; Oberer Waldweg 1, 67281 Kirchheim (DE). UNGER, Liliane [DE/DE]; Wollstr. 129, 67065 Ludwigshafen (DE).

Veröffentlicht:

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

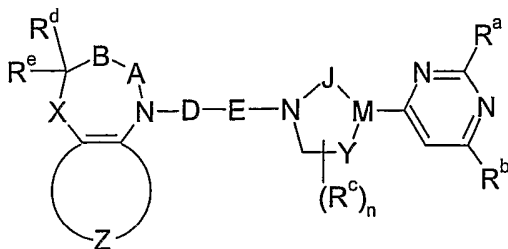
(74) Anwalt: REITSTÖTTER, KINZEBACH & PARTNER; Ludwigsplatz 4, 67059 Ludwigshafen (DE).

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 9. Februar 2006

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.

(54) Title: PYRIMIDINE COMPOUNDS AND USE THEREOF

(54) Bezeichnung: PYRIMIDINVERBINDUNGEN UND IHRE VERWENDUNG



(I) (57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Pyrimidin-Verbindungen der allgemeinen Formel (I), sowie

(57) Abstract: The invention relates to pyrimidine compounds of general formula (I), and to the use of these compounds of general formula (I) and of the physiologically compatible acid addition salts of compounds (I) for producing a pharmaceutical agent for treating diseases, which respond to the influence of dopamine D₃ receptor antagonists or agonists.

die Verwendung dieser Verbindungen der allgemeinen Formel (I), sowie der physiologisch verträglichen Säureadditionssalze der Verbindungen I zur Herstellung eines pharmazeutischen Mittels zur Behandlung von Erkrankungen, die auf die Beeinflussung durch Dopamin-D₃-Rezeptorantagonisten bzw. -agonisten ansprechen.

WO 2005/118558 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/006000

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
C07D401/12 C07D413/12 C07D417/12 A61K31/506 A61P25/36

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)
C07D

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, BEILSTEIN Data, PAJ, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category ° | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| A | WO 97/25324 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TREIBER, HANS-JOERG; BLANK, STEFAN; STARCK, D) 17 July 1997 (1997-07-17) cited in the application page 1, lines 5-9 Seite 4, Formel I page 5, lines 11-19 page 6, lines 25-35 page 7, lines 5-25 page 20, line 25 - page 21, line 20 ----- -/-- | 1-19 |

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 2 November 2005 | Date of mailing of the international search report 05/12/2005 |
|---|---|

| | |
|--|--|
| 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 Hoepfner, W |
|--|--|

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2005/006000

| C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | |
|--|---|-----------------------|
| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
| A | <p>A. ORJALES ET AL.: "New 3-benzothiazolyl and 3-benzisoxazolylpiperazine derivatives with atypical antipsychotic binding profile" EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY., vol. 37, 2002, pages 721-730, XP004383155 EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER; PARIS, FR page 722; figures 1,2 -----</p> | 1-19 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/006000

| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|--|------------------|-------------------------|----------------------------|
| WO 9725324 | A | 17-07-1997 | AT 273301 T 15-08-2004 |
| | | | AU 717726 B2 30-03-2000 |
| | | | AU 1440797 A 01-08-1997 |
| | | | BG 64098 B1 31-12-2003 |
| | | | BG 102616 A 30-04-1999 |
| | | | CA 2241787 A1 17-07-1997 |
| | | | CN 1348956 A 15-05-2002 |
| | | | CN 1212692 A 31-03-1999 |
| | | | CZ 9802159 A3 12-05-1999 |
| | | | DE 19600934 A1 17-07-1997 |
| | | | EP 0877744 A1 18-11-1998 |
| | | | ES 2225947 T3 16-03-2005 |
| | | | HR 970021 A1 30-04-1998 |
| | | | HU 9901590 A2 30-08-1999 |
| | | | IL 125076 A 20-05-2001 |
| | | | JP 2000505072 T 25-04-2000 |
| | | | NO 983187 A 09-09-1998 |
| | | | NZ 326332 A 29-04-1999 |
| | | | PL 327692 A1 21-12-1998 |
| | | | SK 94198 A3 10-03-1999 |
| | | | TR 9801302 T2 23-11-1998 |
| | | | TW 475929 B 11-02-2002 |
| | | | US 6214822 B1 10-04-2001 |
| | | | US 6352981 B1 05-03-2002 |
| | | | ZA 9700209 A 10-07-1998 |

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/006000

| | | |
|---|---|--|
| A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES C07D401/12 C07D413/12 C07D417/12 A61K31/506 A61P25/36 | | |
| Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK | | |
| B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D | | |
| 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, BEILSTEIN Data, PAJ, WPI Data | | |
| C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN | | |
| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
| A | WO 97/25324 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TREIBER, HANS-JOERG; BLANK, STEFAN; STARCK, D) 17. Juli 1997 (1997-07-17) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeilen 5-9 Seite 4, Formel I Seite 5, Zeilen 11-19 Seite 6, Zeilen 25-35 Seite 7, Zeilen 5-25 Seite 20, Zeile 25 - Seite 21, Zeile 20 ----- -/-- | 1-19 |
| <input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen | | |
| <input checked="" type="checkbox"/> 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 | | Absenddatum des internationalen Recherchenberichts |
| 2. November 2005 | | 05/12/2005 |
| 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 Hoepfner, W |

| C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN | | |
|--|--|--------------------|
| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
| A | <p>A. ORJALES ET AL.: "New 3-benzisothiazolyl and 3-benzisoxazolylpiperazine derivatives with atypical antipsychotic binding profile" EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY., Bd. 37, 2002, Seiten 721-730, XP004383155 EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER; PARIS, FR Seite 722; Abbildungen 1,2 -----</p> | 1-19 |

INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/006000

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | Datum der Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| WO 9725324 A | 17-07-1997 | AT 273301 T | 15-08-2004 |
| | | AU 717726 B2 | 30-03-2000 |
| | | AU 1440797 A | 01-08-1997 |
| | | BG 64098 B1 | 31-12-2003 |
| | | BG 102616 A | 30-04-1999 |
| | | CA 2241787 A1 | 17-07-1997 |
| | | CN 1348956 A | 15-05-2002 |
| | | CN 1212692 A | 31-03-1999 |
| | | CZ 9802159 A3 | 12-05-1999 |
| | | DE 19600934 A1 | 17-07-1997 |
| | | EP 0877744 A1 | 18-11-1998 |
| | | ES 2225947 T3 | 16-03-2005 |
| | | HR 970021 A1 | 30-04-1998 |
| | | HU 9901590 A2 | 30-08-1999 |
| | | IL 125076 A | 20-05-2001 |
| | | JP 2000505072 T | 25-04-2000 |
| | | NO 983187 A | 09-09-1998 |
| | | NZ 326332 A | 29-04-1999 |
| | | PL 327692 A1 | 21-12-1998 |
| | | SK 94198 A3 | 10-03-1999 |
| | | TR 9801302 T2 | 23-11-1998 |
| | | TW 475929 B | 11-02-2002 |
| | | US 6214822 B1 | 10-04-2001 |
| | | US 6352981 B1 | 05-03-2002 |
| | | ZA 9700209 A | 10-07-1998 |