(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
4. November 2004 (04.11.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/094406 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 401/12, A61K 31/4439

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/004340

(22) Internationales Anmeldedatum: 23. April 2004 (23.04.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 18 609.3 24. April 2003 (24.04.2003) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **ELBION AG** [DE/DE]; Meissner Strasse 191, 01445 Radebeul (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **HÖFGEN, Norbert** [DE/DE]; Hufenweg 1, 01458 Ottendorf-Okrilla (DE). **KUSS, Hildegard** [DE/DE]; Kieler Str. 6, 01109 Dresden (DE). **STEINIKE, Karin** [DE/DE]; Ledenweg 4c, 01445 Radebeul (DE). **EGERLAND, Ute** [DE/DE]; Magdalenenstr. 1, 01445 Radebeul (DE). **RUNDFELDT, Chris** [DE/DE]; Melanchthonstr. 11, 01640 Coswig (DE). **PFEIFER, Thomas** [DE/DE]; Wichernstr. 5, 01445 Radebeul (DE).

(74) Anwalt: **WEICKMANN & WEICKMANN**; Postfach 860 820, 81635 München (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, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, 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*

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:** 5-HYDROXYINDOLES WITH N-OXIDE GROUPS AND USE THEREOF AS A PHOSPHODIESTERASE 4 INHIBITOR

(54) **Bezeichnung:** 5-HYDROXYINDOLE MIT N-OXIDGRUPPEN UND DEREN VERWENDUNG ALS PHOSPHODIESTERASE 4 HEMMER

(57) **Abstract:** The invention relates to substituted 5-hydroxyindoles with N-oxide groups, a method for the production thereof, pharmaceutical preparations which contain said compounds and the pharmaceutical use of said compounds which are inhibitors of phosphodiesterase 4, as active substances in the treatment of diseases which can be influenced by the said inventive compounds by means of an inhibition of phosphodiesterase 4 activity, especially in immunocompetent cells (for example, macrophages and lymphocytes).

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft substituierte 5-Hydroxyindole mit N-Oxidgruppen, Verfahren zu deren Herstellung, pharmazeutische Zubereitungen, die diese Verbindungen enthalten sowie die pharmazeutische Verwendung dieser Verbindungen, die Inhibitoren der Phosphodiesterase 4 sind, als Wirkstoffe zur Behandlung von Erkrankungen, die mit einer Hemmung der Phosphodiesterase 4-Aktivität insbesondere in immunkompetenten Zellen (z.B. Makrophagen und Lymphozyten) durch die erfindungsgemässen Verbindungen zu beeinflussen sind.

WO 2004/094406 A1