(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
6. August 2009 (06.08.2009)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2009/095503 A2

(51) Internationale Patentklassifikation:
A61K 31/155 (2006.01) *A61P 7/02* (2006.01)
A61K 31/401 (2006.01) *A61P 31/12* (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2009/051162

(22) Internationales Anmeldedatum:
2. Februar 2009 (02.02.2009)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2008 007 440.3 1. Februar 2008 (01.02.2008) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **Dritte Patentportfolio Beteiligungsgesellschaft mbH & Co. KG** [DE/DE]; Berliner Strasse 1, 12529 Schoenefeld (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **CLEMENT, Bernd** [DE/DE]; Johann-Fleck-Strasse 27, 24106 Kiel (DE). **REEH, Christiane** [DE/DE]; Salomon-Heine-Weg 38 a, 20251 Hamburg (DE). **HUNGELING, Helen** [DE/DE]; Theodor-Storm-Strasse 17, 24116 Kiel (DE).

(74) Anwalt: **ZECH, LL.M., Stefan M.**; Postfach 860624, 81633 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: AMINO ACID DERIVATIVES USED AS PHARMACEUTICAL SUBSTANCES

(54) Bezeichnung: AMINOSAEUREDERIVATE ALS ARZNEISTOFFE

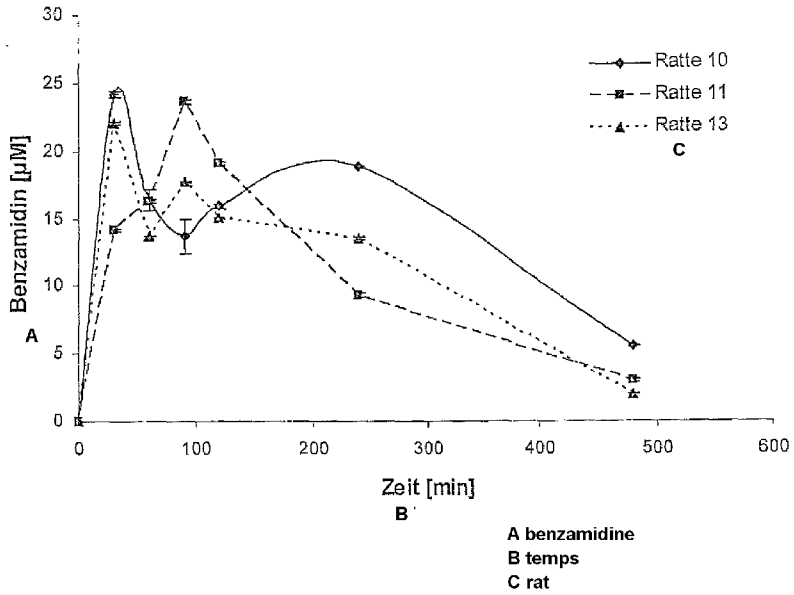


FIG. 1

(57) Abstract: The invention relates to a method for improving bioavailability of pharmaceutical substances and for allowing said pharmaceutical substances to permeate the blood-brain barrier, said pharmaceutical substances having at least one or more amidine, guanidine, N-hydroxyamidine (amidoxime) or N-hydroxyguanidine functions. The invention also relates to medicaments containing correspondingly modified pharmaceutical substances.

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

WO 2009/095503 A2

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, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, 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:

— *ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts*

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Verbesserung der Bioverfugbarkeit und Eimöglichung der Blut-Hirn-Schrankengängigkeit von Arzneistoffen, die wenigstens eine oder mehrere Amidln-, Guanidin-, N-Hydroxyamidin- (Amidoxim) bzw. N-Hydroxyguanidin- Funktionen aufweisen und entsprechend modifizierte Arzneistoffe enthaltende Arzneimittel.