(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
26. August 2004 (26.08.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/072077 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 487/04, A61K 31/519, A61P 3/04 // (C07D 487/04, 241:00, 239:00)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/000770

(22) Internationales Anmeldedatum:
29. Januar 2004 (29.01.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 05 885.0 13. Februar 2003 (13.02.2003) DE
103 49 671.8 24. Oktober 2003 (24.10.2003) DE

(71) Anmelder: **AVENTIS PHARMA DEUTSHLAND GMBH** [DE/DE]; Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt (DE).

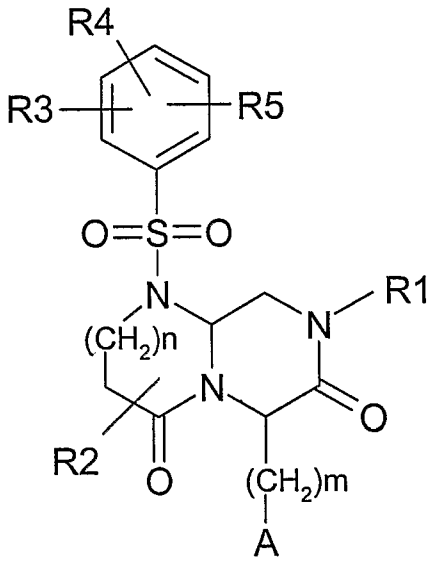
(72) Erfinder: **FLOHR, Stefanie**; St. Galler Ring 142, CH-4054 Basel (CH). **STENGELIN, Siegfried**; Sachsenring 27, 65817 Eppstein (DE). **GOSSEL, Matthias**; Im Losbachtal 17a, 65719 Hofheim (DE). **KLABUNDE, Thomas**; Richard-Biringer-Weg 11, 65929 Frankfurt (DE). **STAHL, Petra**; Pestalozzistrasse 16, 60385 Frankfurt (DE). **SAFAR, Pavel**; 12431 N Forest Lake Way, Tucson, AZ 85737 (US). **SPOONAMORE, James**; 315 W Spring Valley Drive, Tucson, AZ 85737 (US). **SMRCINA, Martin**; 11854 North Crescendo Drive, Tucson, AZ 85737 (US). **KLEIN, Joseph, T.**; 20 Lehigh Road, Neshanic, NJ 08853 (US). **MERRIMAN, Gregory, H.**; 248 Stonehenge Drive, Phillipsburg, NJ 08865 (US). **WHITELEY, Brian, K.**; 1404 Route 22 West, Lebanon, NJ 08833 (US). **LANTER, Carolina**; 3 Albion Court, Flemington, NJ 08822 (US). **BORDEAU, Kenneth, J.**; 211 Durham-Nox Road, Kintersville, PA 18930 (US). **YANG, Zhaoxia**; 600 Ashwood Avenue, Roselle Park, NJ 07204 (US).

(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.

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: NITROGEN-SUBSTITUTED HEXAHYDROPYRAZINO[1,2-A]PYRIMIDINE-4,7-DIONE DERIVATIVES, METHOD FOR THE PRODUCTION AND USE THEREOF AS MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: STICKSTOFF SUBSTITUIERTE HEXAHYDRO-PYRAZINO[1,2-a]PYRIMIDIN-4,7-DIONDERIVATE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL



(I)

(57) Abstract: The invention relates to nitrogen-substituted hexahydropyrazino[1,2-a]pyrimidine-4,7-dione derivatives, in addition to the physiologically compatible salts thereof and physiologically functional derivatives. The invention also relates to compounds of formula (I), wherein the radicals have the cited meanings, the physiologically compatible salts thereof and methods for the production thereof. Said compounds can be used, for example, as anorectics.

(57) Zusammenfassung: Stickstoff substituierte Hexahydro-pyrazino[1,2-a]pyrimidin-4,7-dionderivate, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Arzneimittel. Die Erfindung betrifft substituierte Hexahydro-pyrazino[1,2-a]pyrimidin-4,7-dionderivate sowie deren physiologisch verträgliche Salze und physiologisch funktionelle Derivate. Es werden Verbindungen der Formel (I), worin die Reste die angegebenen Bedeutungen haben, sowie deren physiologisch verträglichen Salze und Verfahren deren Herstellung beschrieben. Die Verbindungen eignen sich z.B. als Anorektika.

WO 2004/072077 A1

(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, 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.