(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
25. Oktober 2001 (25.10.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/79186 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 239/84, A61K 31/517, A61P 9/10

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/03281

(22) Internationales Anmeldedatum:
22. März 2001 (22.03.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 19 062.6 18. April 2000 (18.04.2000) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **MERCK PATENT GMBH** [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **GERICKE, Rolf** [DE/DE]; Mozartstrasse 19, 64342 Seeheim (DE). **BEIER, Norbert** [DE/DE]; Max.-Kolbe-Strasse 11, 64354 Reinheim (DE). **WILM, Claudia** [DE/DE]; Dahlienweg 26, 64281 Darmstadt (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH**; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, 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, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

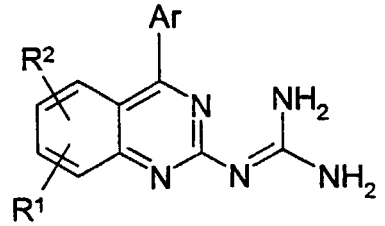
— *mit internationalem Recherchenbericht*

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

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:** 2-GUANIDINO-4-ARYLCHINAZOLINES AS NHE-3 INHIBITORS

(54) **Bezeichnung:** 2-GUANIDINO-4-ARYL-CHINAZOLINE ALS NHE-3-INHIBITOREN



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to compounds of formula (I), where Ar = unsubstituted, or monosubstituted by R^3, phenyl, or naphthyl; R^1, R^2 = independently, A, OA, Hal or CF_3; R^3 = A, OA, Hal, or CF_3; A = 1-6C alkyl and Hal = F, Cl, Br or I and the salts and solvates thereof as NHE3 inhibitors.

(57) **Zusammenfassung:** Verbindungen der Formel (I), worin Ar unsubstituiertes oder einfach durch R^3 substituiertes Phenyl oder Naphthyl, R^1, R^2 jeweils unabhängig voneinander H, A, OA, Hal oder CF_3, R^3 A, OA, Hal oder CF_3, A Alkyl mit 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 C-Atomen, Hal F, Cl, Br oder I bedeutet, sowie deren Salze und Solvate als NHE-3-inhibitoren.

WO 01/79186 A1