2004073722

07 DEC 2004

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

*162162*

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
18. Dezember 2003 (18.12.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/104227 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 453/02, A61K 31/439, A61P 25/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/05735

(22) Internationales Anmeldedatum: 2. Juni 2003 (02.06.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

| | | |
|---|---|---|
| 102 25 536.9 | 10. Juni 2002 (10.06.2002) | DE |
| 102 57 078.7 | 6. Dezember 2002 (06.12.2002) | DE |
| 102 57 537.1 | 10. Dezember 2002 (10.12.2002) | DE |
| 103 05 922.9 | 13. Februar 2003 (13.02.2003) | DE |

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **BAYER HEALTHCARE AG** [DE/DE]; 51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **LUITHLE, Joachim** [DE/DE]; Kastanienallee 29a, 42489 Wülfrath (DE). **BÖSS, Frank-Gerhard** [DE/DE]; Auf dem Scheidt 29f, 42115 Wuppertal (DE). **ERB, Christina** [DE/DE]; Uhlandstr. 4, Kriftel 65830 (DE). **HAFNER, Frank-Thorsten** [DE/DE]; Nützenberger Str. 206, 42115 Wuppertal (DE). **SCHNIZLER, Katrin** [DE/DE]; Odenwaldstr. 21, 63517 Rodenbach (DE). **FLEsSNER, Timo** [DE/DE]; Egenstr. 64, 42113 Wuppertal (DE). **VAN KAMPEN, Marja** [DE/DE]; Ahnenweg 2, 40219 Düsseldorf (DE). **VAN DER STAAY, Franz-Josef** [DE/DE]; Matthias-Claudius-Weg 15a, 53797 Lohmar (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER HEALTHCARE AG**; 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, 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, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (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-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

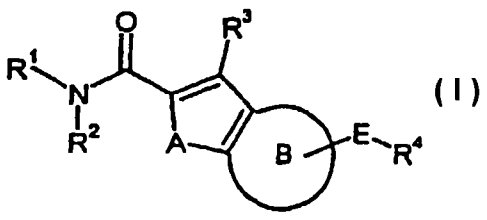
**Erklärung gemäß Regel 4.17:**

— *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,*

*[Fortsetzung auf der nächsten Seite]*

(54) Title: 2-HETEROARYL CARBOXAMIDES

(54) Bezeichnung: 2-HETEROARYLCARBONSÄUREAMIDE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to the novel 2-heteroaryl carboxamides according to formula (I), wherein $R^1$ represents 1-aza-bicyclo [2.2.2]oct-3-yl, which is optionally replaced via the nitrogen atom by a group selected from the family $C_1$-$C_4$ alkyl, benzyl and oxy, A represents oxygen or sulfur, the ring B represents benzo or pyrido that are optionally replaced by the groups from the family of halogen, cyano, formyl, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, nitro, amino, $C_1$-$C_6$ alkyl and $C_1$-$C_6$ alkoxy, E represents C=C, aryl and heteroaryl, wherein aryl and heteroaryl may be replaced by groups from the family of halogen, cyano, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, nitro, amino, $C_1$-$C_6$ alkoxy and $C_1$-$C_6$ alkyl, and to the solvents, salts or solvents of salts of said compounds. The invention also relates to the use of said compounds in the production of drugs for the treatment and/or the prophylaxis of diseases and for improving perception, power of concentration, learning power and/or retentiveness of memory.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue 2-Heteroarylcarbonsäureamide und ihre Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krankheiten und zur Verbesserung der Wahrnehmung, Konzentrationsleistung, Lernleistung und/oder Gedächtnisleistung. (I): in welcher $R^1$ 1-Aza-bicyclo [2.2.2]oct-3-yl, welches gegebenenfalls über das Sticktoffatom mit einem Rest ausgewählt aus der Gruppe $C_1$-$C_4$-Alkyl, Benzyl und Oxy substituiert ist, A Sauerstoff oder Schwefel, der Ring B Benzo oder Pyrido, die jeweils gegebenenfalls durch Reste aus der Reihe Halogen, Cyano, Formyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Amino, $C_1$-$C_6$-Alkyl und $C_1$-$C_6$-Alkoxy substituiert sind, E C≡C, Aryl und Heteroaryl, wobei Aryl und Heteroaryl durch Reste aus der Reihe Halogen, Cyano, Trifluormethyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Amino, $C_1$-$C_6$-Alkoxy und $C_1$-$C_6$-Alkyl substituiert sein Können, bedeuten, sowie die Solvate, Salze oder Solvate der Salze dieser Verbindungen.

WO 03/104227 A1

*ACTION*

*AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, 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, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (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-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, 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.*