2004068342

22 NOV 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
11. Dezember 2003 (11.12.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/101984 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 409/12, A61K 31/4168, A61P 11/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/05465

(22) Internationales Anmeldedatum:
26. Mai 2003 (26.05.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 24 892.3 4. Juni 2002 (04.06.2002) DE

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

(72) Erfinder: **LANG, Hans-Jochen**; Rüdesheimer Strasse 7, 65719 Hofheim (DE). **HEINELT, Uwe**; Mosbacher Strasse 54, 65187 Wiesbaden (DE). **HOFMEISTER, Armin**; Pfaugasse 16, 55276 Oppenheim (DE). **WIRTH, Klaus**; Robert-Schumann-Ring 104, 65830 Kriftel (DE). **GEKLE, Michael**; Schiesshausstrasse 11, 97072 Würzburg (DE). **BLEICH, Markus**; Eufinger Strasse 73, 65597 Hünfelden-Dauborn (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, 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).

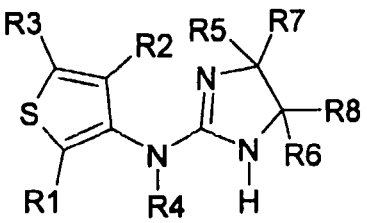
Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

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:** SUBSTITUTED THIOPHENES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF, THEIR USE AS A MEDICAMENT OR DIAGNOSTIC REAGENT, AND A MEDICAMENT CONTAINING THE SAME

(54) **Bezeichnung:** SUBSTITUIERTE THIOPHENE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG, IHRE VERWENDUNG ALS MEDIKAMENT ODER DIAGNOSTIKUM SOWIE SIE ENTHALTENDES MEDIKAMENT

(I)



(57) **Abstract:** The invention relates to substituted thiophene derivatives of formula (I), wherein: R1 to R8 have the meanings as cited in the claims. Medicaments containing compounds of this type are useful in preventing or treating various diseases. Thus, these compounds can be used, among other things, for treating breathing disturbances and snoring, for improving the breathing drive, for treating acute and chronic diseases, diseases triggered by ischemic and/or reperfusion events as well as by proliferative or fibrotic events, for the treatment or prophylaxis of diseases of the central nervous system, lipid metabolism and diabetes, blood clotting and parasitic infection.

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft substituierte Thiophen-Derivate der Formel (I) worin R1 bis R8 die in den Ansprüchen wiedergegebenen Bedeutungen haben. Medikamente, die Verbindungen dieses Typs enthalten, sind nützlich bei der Prävention oder Behandlung diverser Erkrankungen. So lassen sich die Verbindungen unter anderem verwenden zur Behandlung von Atemstörungen und des Schnarchens sowie zur Verbesserung des Atemantriebes, zur Behandlung von akuten und chronischen Erkrankungen, durch ischämische und/oder Reperfusionsereignisse sowie durch proliferative oder durch fibrotische Ereignisse ausgelösten Erkrankungen, zur Behandlung oder Prophylaxe von Erkrankungen des zentralen Nervensystems, des Fettstoffwechsels und des Diabetes, der Blutgerinnung und des Befalls durch Parasiten.

WO 03/101984 A1

ACTION