

(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
4. September 2003 (04.09.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/072555 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 271/113**,
A61K 31/4245, A61P 3/04

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/01484

(22) Internationales Anmeldedatum:
14. Februar 2003 (14.02.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 08 987.6 28. Februar 2002 (28.02.2002) 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, 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, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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

(72) Erfinder: **SCHOENAFINGER, Karl**; Holunderweg 8, 63755 Alzenau (DE). **PETRY, Stefan**; Johannesallee 12, 65929 Frankfurt (DE). **MÜLLER, Günter**; Im Haindell 1b, 65843 Sulzbach a. Ts. (DE). **BAUER, Armin**; Obere Borngasse 2c, 65843 Sulzbach (DE). **HEUER, Hubert, Otto**; Am Sportfeld 74, 55270 Schwabenheim (DE).

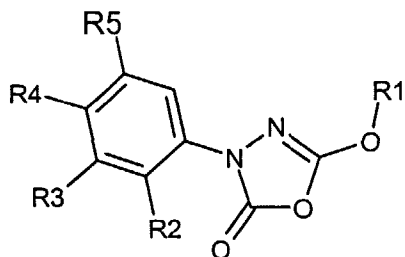
Veröffentlicht:

- 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: SUBSTITUTED 3-PHENYL-5-ALKOXY-1,3,4-OXADIAZOL-2-ONES, THE PRODUCTION THEREOF AND THEIR USE IN MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE 3-PHENYL-5-ALKOXY-1,3,4-OXADIAZOL-2-ONE SOWIE IHRE HERSTELLUNG UND VERWENDUNG IN ARZNEISTOFFEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to substituted 3-phenyl-5-alkoxy-1,3,4-oxadiazol-2-ones, of general formula (I), wherein R¹ represents C₇-C₂₂ alkyl, C₂-C₄ alkyl that is substituted by C₄-C₂₀ alkoxy, C₆-C₁₀ aryl, C₆-C₁₀ aryloxy or C₄-C₁₂-alkoxy-C₂-C₄-alkoxy, and represents C₇-C₂₀ alkenyl, 3 β -cholestan-3-yl or substituted phenyl; R², R³, R⁴ and R⁵ represent hydrogen, halogen, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₉ alkyloxy, trifluoromethyl, trifluoromethoxy or C₆-C₁₀-aryl-C₁-C₄-alkyloxy, C₆-C₁₀ aryloxy, C₆-C₁₀ aryl, C₃-C₈ cycloalkyl or O-C₃-C₈-cycloalkyl, whereby all of these can be substituted. The invention also relates to methods for producing these compounds. The compounds of formula

(I) have an inhibiting effect on the pancreatic lipase and can be used as active substances for treating obesity.

(57) Zusammenfassung: Es werden substituierte 3-Phenyl-5-alkoxy-1,3,4-oxadiazol-2-one der allgemeinen Formel (I) beschrieben, worin R¹ C₇-C₂₂-Alkyl; durch C₄-C₂₀-Alkoxy, C₆-C₁₀-Aryl, C₆-C₁₀-Aryloxy oder C₄-C₁₂-Alkoxy-C₂-C₄-Alkoxy substituiertes C₂-C₄-Alkyl, C₇-C₂₀-Alkenyl; 3 β -Cholestan-3-yl oder substituiertes Phenyl; R², R³, R⁴ und R⁵ Wasserstoff, Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₉-Alkyloxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, oder C₆-C₁₀-Aryl-C₁-C₄-Alkyloxy, C₆-C₁₀-Aryloxy, C₆-C₁₀-Aryl, C₃-C₈-Cycloalkyl oder O-C₃-C₈-Cycloalkyl, die substituiert sein können, bedeuten sowie deren Herstellungsverfahren. Die Verbindungen der Formel (I) üben eine hemmende Wirkung auf die pankreatische Lipase aus und können als Wirkstoffe zur Behandlung von Obesitas eingesetzt werden.

WO 03/072555 A1