

(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
27. November 2003 (27.11.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/097591 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07C 381/00**,
A61P 9/06, 9/10, A61K 31/155

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/04669

(22) Internationales Anmeldedatum:
5. Mai 2003 (05.05.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 22 192.8 18. Mai 2002 (18.05.2002) DE

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

(72) Erfinder: **KLEEMANN, Heinz-Werner**; Mainstrasse 29,
65474 Bischofsheim (DE).

(74) Anwalt: **AVENTIS PHARMA DEUTSCHLAND
GMBH**; Patent- und Lizenzabteilung, Industriepark
Höchst, Geb. K 801, 65926 Frankfurt (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).

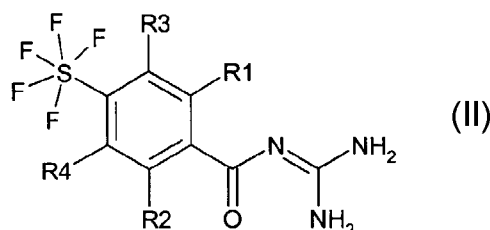
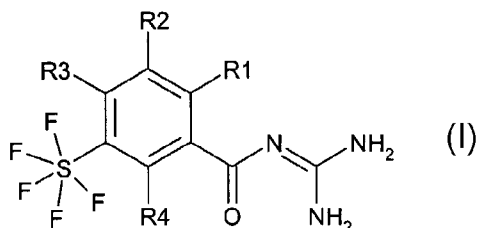
Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: PENTAFLUORSULFANYL-BENZOYLGUANIDINE, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND ITS UTILIZATION AS MEDICAMENT OR DIAGNOSTIC AGENT AND MEDICAMENT CONTAINING SAME

(54) Bezeichnung: PENTAFLUORSULFANYL-BENZOYLGUANIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERTELLUNG, IHRE VERWENDUNG ALS MEDIKAMENT ODER DIAGNOSTIKUM SOWIE SIE ENTHALTENDES MEDIKAMENT



(57) Abstract: The invention relates to pentafluorosulfanyl-benzoylguanidines of formula (I) and (II), wherein R₁ to R₄ have the meaning mentioned in the claims. Said pentafluorosulfanyl-benzoylguanidines are suitable as antiarrhythmic medicaments with cardioprotective components for the prophylaxis or treatment of infarction and for the treatment of angina pectoris. They also preventively inhibit pathophysiological processes during the occurrence of ischaemically induced injuries, more particularly the triggering of ischaemically induced cardiac arrhythmia.

(57) Zusammenfassung: Pentafluorsulfanyl-benzoylguanidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, ihre Verwendung als Medikament oder Diagnostikum sowie sie enthaltendes Medikament 5 Pentafluorsulfanyl-benzoylguanidine der Formula (I) and (II) worin R₁ bis R₄ die in den Ansprüchen angegebenen Bedeutungen haben, sind als 10 antiarrhythmische Arzneimittel mit cardioprotektiver Komponente zur Infarktprophylaxe und der Infarktbehandlung sowie zur Behandlung der angina pectoris geeignet. Sie inhibieren auch präventiv die pathophysiologischen Vorgänge beim Entstehen ischämisch induzierter Schäden, insbesondere bei der Auslösung ischämisch induzierter Herzarrhythmien.



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.