(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. November 2004 (04.11.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/094405 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 401/12, A61K 31/4439, A61P 11/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/004338

(22) Internationales Anmeldedatum:
23. April 2004 (23.04.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 18 611.5 24. April 2003 (24.04.2003) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **ELBION AG** [DE/DE]; Meissner Strasse 191, 01445 Radebeul (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **HÖFGEN, Norbert** [DE/DE]; Hufenweg 1, 01458 Ottendorf-Okrilla (DE). **KUSS, Hildegard** [DE/DE]; Kieler Strasse 6, 01109 Dresden (DE). **STEINIKE, Karin** [DE/DE]; Ledenweg 4c, 01445 Radebeul (DE). **EGERLAND, Ute** [DE/DE]; Magdalenenstrasse 1, 01445 Radebeul (DE). **RUNDFELDT, Chris** [DE/DE]; Melanchthonstrasse 11, 01640 Coswig (DE).

(74) Anwalt: **WEICKMANN & WEICKMANN**; Postfach 860 820, 81635 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, 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, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

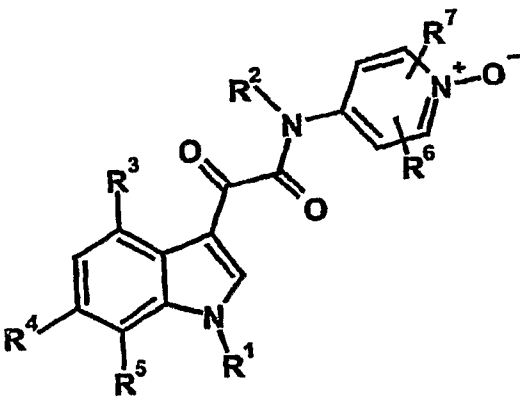
(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (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:** 4-, 6- O 7-HYDROXYINDOLES HAVING N-OXIDE GROUPS AND THE USE THEREOF AS THERAPEUTIC AGENTS

(54) **Bezeichnung:** 4-, 6- ODER 7-HYDROXYINDOLE MIT N-OXIDGRUPPEN UND DEREN VERWENDUNG ALS THERAPEUTIKA



(I)

(57) **Abstract:** The invention relates to substituted 4-, 6- or 7-hydroxyindoles having N-oxide groups of formula (I), a method for the production thereof, pharmaceutical preparations comprising said compounds and the pharmaceutical use of said compounds which are inhibitors of phosphodiesterase 4, as active substances in the treatment of diseases which can be influenced by said inventive compounds by means of an inhibition of phosphodiesterase 4 activity, especially in immunocompetent cells (for example, macrophages and lymphocytes).

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft substituierte 4-, 6- oder 7-Hydroxyindole mit N-Oxidgruppen der Formel (I), Verfahren zu deren Herstellung, pharmazeutische Zubereitungen, die diese Verbindungen enthalten sowie die pharmazeutische Verwendung dieser Verbindungen, die Inhibitoren der Phosphodiesterase 4 sind, als Wirkstoffe zur Behandlung von Erkrankungen, die mit einer Hemmung der Phosphodiesterase 4-Aktivität insbesondere in immunkompetenten Zellen (z.B. Makrophagen und Lymphozyten) durch die erfindungsgemässen Verbindungen zu beeinflussen sind.

WO 2004/094405 A1

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.