(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
1. März 2001 (01.03.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/14332 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 211/18, 409/06, 405/06, 417/06, 401/06, A61K 31/445, 31/4523, A61P 25/00, 25/16, 25/18

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/07664

(22) Internationales Anmeldedatum:
8. August 2000 (08.08.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
199 39 756.2 21. August 1999 (21.08.1999) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **MERCK PATENT GMBH** [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **PRÜCHER, Helmut** [DE/DE]; Königsbergerstrasse 9, 64646 Heppenheim (DE). **BÖTTCHER, Henning** [DE/DE]; Theodor-Heuss-Strasse 13, 64287 Darmstadt (DE). **ACKERMANN, Karl-August** [DE/DE]; Am Pfarrweiher 40, 64372 Ober-Ramstadt (DE). **GOTTSCHLICH, Rudolf** [DE/DE]; Buchenweg 1, 64354 Reinheim (DE). **GREINER, Hartmut** [DE/DE]; Kreuzstrasse 54, 64331 Weiterstadt (DE). **HARTING, Jürgen** [DE/DE]; Rodinghweg 15, 64287 Darmstadt (DE). **BARTOSZYK, Gerd** [DE/DE]; Kreuzstrasse 57, 64331 Weiterstadt (DE). **SEYFRIED, Christoph** [DE/DE]; Mathildenstrasse 6, 64342 Seeheim-Jugenheim (DE). **VAN AMSTERDAM, Christoph** [DE/DE]; Schepp Allee 47, 64295 Darmstadt (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH**; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, 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, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

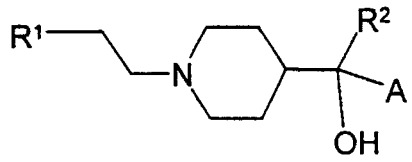
(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, 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.

(54) Title: PIPERIDINE ALCOHOLS

(54) Bezeichnung: PIPERIDINALKOHOLE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I), wherein R^1, R^2 and A have the meanings given in claim 1, are potent 5-HT_{2A} antagonists and are suitable for treating psychoses, schizophrenia, depression, neurological disorders, impaired memory, Parkinson's disease, amyotrophic lateral sclerosis, Alzheimer's disease, Huntington's disease, eating disorders such as bulimia and anorexia nervosa, Pre-Menstrual Syndrome and/or for positively influencing obsessive-compulsive disorders, (OCD).

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel (I), worin R^1, R^2 und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen besitzen, sind potente 5-HT_{2A}-Antagonisten und eignen sich zur Behandlung von Psychosen, Schizophrenie, Depression, neurologischen Störungen, Gedächtnisstörungen, Morbus Parkinson, amyotropher Lateralsklerose, der Alzheimer Krankheit, der Huntington Krankheit, Essstörungen wie Bulimie, nervöser Anorexie, des prämenstrualen Syndroms und/oder zur positiven Beeinflussung von Zwangsverhalten (obsessive-compulsive disorder, OCD).

WO 01/14332 A1