(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. Februar 2001 (01.02.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/07434 A3

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 209/12, A61K 31/404, A61P 43/00, C07D 403/06, 409/06

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/06463

(22) Internationales Anmeldedatum:
7. Juli 2000 (07.07.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
199 34 432.9 22. Juli 1999 (22.07.1999) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **BÖTTCHER, Henning** [DE/DE]; Theodor-Heuss-Strasse 13, D-64287 Darmstadt (DE). **MÄRZ, Joachim** [DE/DE]; Neckarring 71, D-64521 Groß-Gerau (DE). **GREINER, Hartmut** [DE/DE]; Kreuzstrasse 57, D-64331 Weiterstadt (DE). **HARTING, Jürgen** [DE/DE]; Rodinghweg 15, D-64287 Darmstadt (DE). **BARTOSZYK, Gerd** [DE/DE]; Kreuzstrasse 57, D-64331 Weiterstadt (DE). **SEYFRIED, Christoph** [DE/DE]; Mathildenstrasse 6, D-64342 Seeheim-Jugenheim (DE). **VAN AMSTERDAM, Christoph** [DE/DE]; Schepp Allee 47, D-64295 Darmstadt (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **MERCK PATENT GMBH**; D-64271 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).

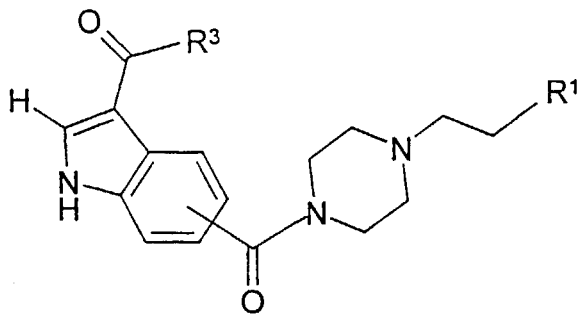
Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 16. Mai 2002

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: INDOLE DERIVATIVES AND THEIR USE AS 5HT2A LIGANDS

(54) Bezeichnung: INDOLDERIVATE UND DEREN VERWENDUNG ALS 5HT2A LIGANDEN



(I)

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I), wherein R^1 and R^3 have the meaning given in Claim 1. Said compounds are potent 5-HT_{2A}-antagonists and are suitable for the treatment of psychosis, schizophrenia, depression, neurological disorders, memory disorders, Parkinson's disease, amyotrophic lateral sclerosis, Alzheimer's disease, Huntington's disease, eating disorders, e.g. nervous bulimia and anorexia, and premenstrual syndrome and/or for positively influencing compulsive behaviours (obsessive-compulsive disorder, OCD).

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel (I), worin R^1 und R^3 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 01/07434 A3