(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
14. Oktober 2004 (14.10.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/087692 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: C07D 405/12, A61K 31/495

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/002351

(22) Internationales Anmeldedatum:
8. März 2004 (08.03.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 15 285.7 4. April 2003 (04.04.2003) 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)*: **SCHIEMANN, Kai** [DE/DE]; Am Rödergraben 8, 64342 Seeheim-Jugenheim (DE). **BÖTTCHER, Henning** [DE/DE]; Stiftstrasse 12, 64287 Darmstadt (DE). **HEINRICH, Timo** [DE/DE]; Franz-Gruber-Strasse 30, 64823 Gross-Umstadt (DE). **HÖLZEMANN, Günter** [DE/DE]; Gutenbergstrasse 6B, 64342 Seeheim-Jugenheim (DE). **VAN AMSTERDAM, Christoph** [DE/DE]; Schepp Allee 47, 64295 Darmstadt (DE). **BARTOSZYK, Gerd** [DE/DE]; Kreuzstrasse 57, 64331 Weiterstadt (DE). **LEIBROCK, Joachim** [DE/DE]; Mühlstrasse 91a, 64319 Pfungstadt (DE). **SEYFRIED, Christoph** [DE/DE]; Mathildenstrasse 6, 64342 Seeheim-Jugenheim (DE).

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

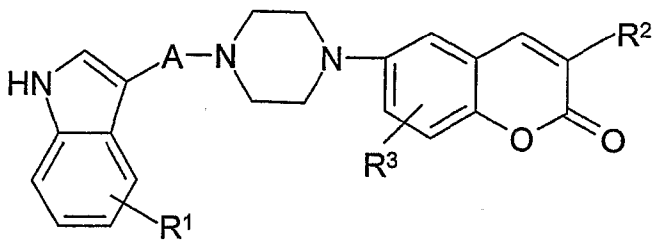
(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, 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*

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: CHROMENONE INDOLES

(54) Bezeichnung: CHROMENONINDOLE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to the chromenone indole derivatives of formula (I), wherein R^1, R^2, R^3, R, A and B are defined as in claim 1 and to the pharmaceutically useful prodrugs, derivatives, solvates, stereoisomers and salts thereof. The inventive substances have particular effects on the central nervous system, in particularly they are 5 HT reuptake inhibitors and 5 HT_x agonists and/or antagonists. They are characterized by an especially good bioavailability and excellent inhibition of 5 HT reuptake.

(57) Zusammenfassung: Chromenonindol-Derivate der Formel (I) worin R^1, R^2, R^3, R, A und B die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen besitzen, sowie deren pharmazeutisch verwendbaren Prodrugs, Derivate, Solvate, Stereoisomere und Salze zeigen besondere Wirkungen auf das Zentralnervensystem, vor allem 5 HT-Wiederaufnahme hemmende und 5 HT_x-agonistische und/oder-antagonistische Wirkungen. Sie zeichnen sich durch eine besonders hohe Bioverfügbarkeit und eine besonders hohe Hemmung der 5 HT-Wiederaufnahme aus.

WO 2004/087692 A1