

(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  
6. Dezember 2001 (06.12.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 01/91797 A3

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 47/20, 31/565, 31/566, 31/568, 31/49, 31/4045, A61P 43/00
- (74) Gemeinsamer Vertreter: CRAMER, Eva-Maria; European Patent Attorney, Jenapharm GmbH & Co. KG, Otto-Schott-Strasse 15, 07745 Jena (DE).
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/05169
- (81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AU, BA, BB, BG, BR, CA, CN, CO, CR, CU, CZ, DM, DZ, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KP, KR, LC, LK, LR, LS, MA, MG, MN, MX, NO, NZ, PL, SG, SK, TT, UA, US, UZ, VN, YU, ZA.
- (22) Internationales Anmeldedatum: 8. Mai 2001 (08.05.2001)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (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, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (30) Angaben zur Priorität: 100 27 887.6 31. Mai 2000 (31.05.2000) DE
- (71) Anmelder (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): JENAPHARM GMBH & CO. KG [DE/DE]; Otto-Schott-Strasse 15, 07745 Jena (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): ELGER, Walter [DE/DE]; Schorlemerallee 12b, 14195 Berlin (DE). HILLISCH, Alexander [AT/DE]; Herderstrasse 28, 07743 Jena (DE). HEDDEN, Annemarie [DE/DE]; Saselkoppel 3, 22393 Hamburg (DE). SCHWARZ, Sigfrid [DE/DE]; Ottogerd-Mühlmann-Strasse 17, 07743 Jena (DE). SCHÖLLKOPF, Klaus [DE/DE]; Schramberger Strasse 34, 13467 Berlin (DE).
- Veröffentlicht:  
— mit internationalem Recherchenbericht
- (88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 20. Juni 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: COMPOUNDS WITH A SULPHONAMIDE GROUP AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING THESE COMPOUNDS

(54) Bezeichnung: VERBINDUNGEN MIT EINER SULFONAMIDGRUPPE UND DIESE VERBINDUNGEN ENTHALTENDE PHARMAZEUTISCHE ZUSAMMENSETZUNGEN

(57) Abstract: The invention relates to compounds which, acting as a prodrug and/or support, enable an active agent to be taken up by the erythrocytes and/or an active agent to bind to the erythrocytes. The uptake of these compounds by and/or the binding thereof to the erythrocytes is made possible by a group of formula  $-SO_2NR^1R^2$ , wherein  $R^1$  and  $R^2$ , independently of each other, mean a hydrogen atom, an acyl group, an alkyl group, a cycloalkyl group, an aryl group, a cyano group or a hydroxy group. The inventive prodrugs enable active agents such as endogenous substances, natural substances and synthetic substances with therapeutically useful properties which have a high "first pass" effect, to be administered orally effectively or significantly improve the oral activity thereof.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Verbindungen, die als Prodrug und/oder Träger die Aufnahme eines Wirkstoffs in die Erythrozyten und/oder die Bindung eines Wirkstoffs an die Erythrozyten ermöglichen, wobei die Aufnahme der Verbindungen in und/oder die Bindung der Verbindungen an die Erythrozyten durch eine Gruppe  $-SO_2NR^1R^2$  ermöglicht wird, wobei  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Acylgruppe, eine Alkylgruppe, eine Cycloalkylgruppe, eine Arylgruppe, eine Cyanogruppe oder eine Hydroxygruppe bedeuten. Durch die erfindungsgemäßen Prodrugs werden Wirkstoffe, wie körpereigene Substanzen, Naturstoffe und synthetische Substanzen mit therapeutisch wertvollen Eigenschaften mit hohem "first pass" Effekt sinnvoll oral verfügbar gemacht bzw. bezüglich oraler Aktivität entscheidend verbessert.



WO 01/91797 A3

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International Application No  
PCT/EP 01/05169

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

IPC 7 A61K47/20 A61K31/565 A61K31/566 A61K31/568 A61K31/49  
A61K31/4045 A61P43/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data, BIOSIS, MEDLINE

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	BARTH A ET AL: "INFLUENCE OF SUBCHRONIC ADMINISTRATION OF OESTRADIOL, ETHINYLOESTRADIOL AND OESTRADIOL SULPHAMATE ON BILE FLOW, BILE ACIDEXCRETION, AND LIVER AND BILIARY GLUTATHIONE STATUS IN RATS" ARCHIVES OF TOXICOLOGY, SPRINGER VERLAG, DE, vol. 71, no. 7, 1997, pages 443-449, XP000986430 ISSN: 0340-5761	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	abstract --- -/--	1-26

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*Z\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

14 January 2002

Date of mailing of the international search report

23/01/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Herrera, S

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 01/05169

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	ELGER W ET AL: "SULFAMATES OF VARIOUS ESTROGENS ARE PRODRUGS WITH INCREASED SYSTEMIC AND REDUCED HEPATIC ESTROGENICITY AT ORAL APPLICATION" JOURNAL OF STEROID BIOCHEMISTRY AND MOLECULAR BIOLOGY, ELSEVIER SCIENCE LTD., OXFORD, GB, vol. 55, no. 3/4, 1995, pages 395-403, XP000618892 ISSN: 0960-0760	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	abstract	1-26
X	WO 97 14712 A (JENAPHARM GMBH) 24 April 1997 (1997-04-24)	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	claims	1-26
X	WO 00 06475 A (HARTLEPP KARL HEINZ ;BRUUN BRIAN (DK); CRISPLANT AS (DK); MATANIN) 10 February 2000 (2000-02-10)	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	claims	1-26
X	WO 93 05064 A (IMPERIAL COLLEGE) 18 March 1993 (1993-03-18)	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	claims	1-26
X	WO 96 05216 A (JENAPHARM GMBH ;SIEMANN CHRISTEL & HF (DE); SCHWARZ SIGFRID (DE);) 22 February 1996 (1996-02-22)	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	claims	1-26
X	US 4 792 569 A (MARYANOFF BRUCE E ET AL) 20 December 1988 (1988-12-20)	1-8,11, 12
X	US 5 025 031 A (LO YOUNG S ET AL) 18 June 1991 (1991-06-18)	1-8,11, 12
X	WO 94 14827 A (MCNEILAB INC) 7 July 1994 (1994-07-07)	1-8,11, 12
X	WO 94 26702 A (WARNER LAMBERT CO) 24 November 1994 (1994-11-24)	1-8,11, 12
	--- -/--	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 01/05169

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	MARYANOFF B E ET AL: "ANTICONVULSANT SUGAR SULFAMATES. POTENT CYCLIC SULFATE AND CYCLIC SULFITE ANALOGUES OF TOPIRAMATE" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, OXFORD, GB, vol. 3, no. 12, 1993, pages 2653-2656, XP000914306 ISSN: 0960-894X the whole document ---	1-8, 11-13
X	DE 12 03 042 B (SCHERING AG) the whole document ---	1-9
X	US 4 513 006 A (MARYANOFF BRUCE E ET AL) 23 April 1985 (1985-04-23) claims ---	1-7, 11, 12
E	WO 01 51055 A (PROSKE HENRICH THOMAS ;SCHERING AG (DE); ELGER WALTER (DE); RODDER) 19 July 2001 (2001-07-19) page 9, line 28 -page 10, line 3; claims 1-26 -----	1-8, 11-13, 20,23,24

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP 01 05169

Continued from box I.2

The patent claims relate to a disproportionate number of possible compounds/products/devices/methods, only a small proportion of which are supported by the description within the meaning of PCT Art. 6 and/or are disclosed in the patent application within the meaning of PCT Art. 5. In the present case, the patent claims lack the appropriate support and the patent application lacks the necessary disclosure to the extent that a meaningful search covering the entire scope of protection sought seems impossible. The search was therefore restricted to those parts of the patent claims which appear to be supported and disclosed within the above meaning, i.e. the parts concerning the compounds in which the active agent is defined as in claim nos. 10 and 20 to 26.

The applicant is advised that patent claims relating to inventions for which no international search has been produced cannot normally be the subject of an international preliminary examination (PCT Rule 66.1(e)). As a general rule, the EPO in its capacity as the authority entrusted with the task of carrying out an international preliminary examination will not conduct a preliminary examination for subjects in respect of which no search has been provided. This also applies to cases where the patent claims were amended after receipt of the international search report (PCT Article 19) or to cases where the applicant presents new patent claims in the course of the PCT Chapter II procedure.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/05169

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9714712	A	24-04-1997	DE 19540233 A1	24-04-1997
			AT 178903 T	15-04-1999
			AU 1436097 A	07-05-1997
			BR 9610905 A	13-07-1999
			CN 1200126 A	25-11-1998
			WO 9714712 A2	24-04-1997
			DE 59601683 D1	20-05-1999
			EP 0862577 A2	09-09-1998
			ES 2131972 T3	01-08-1999
			GR 3030733 T3	30-11-1999
			JP 11505268 T	18-05-1999
			US 5705495 A	06-01-1998
			WO 0006475	A
WO 0006475 A1	10-02-2000			
EP 1100736 A1	23-05-2001			
US 6259967 B1	10-07-2001			
WO 9305064	A	18-03-1993	AT 194843 T	15-08-2000
			AU 717116 B2	16-03-2000
			AU 1007799 A	04-03-1999
			AU 668882 B2	23-05-1996
			AU 2490592 A	05-04-1993
			AU 689043 B2	19-03-1998
			AU 5837396 A	05-09-1996
			AU 7195298 A	13-08-1998
			BR 9206434 A	27-09-1994
			CA 2114630 A1	18-03-1993
			CZ 9400440 A3	18-01-1995
			DE 69231280 D1	24-08-2000
			DE 69231280 T2	30-11-2000
			DK 641355 T3	09-10-2000
			EP 1099706 A2	16-05-2001
			EP 0641355 A1	08-03-1995
			EP 0928609 A2	14-07-1999
			EP 0921130 A2	09-06-1999
			EP 0982032 A2	01-03-2000
			ES 2148178 T3	16-10-2000
			FI 940903 A	20-04-1994
			FI 20002259 A	13-10-2000
			FI 20002260 A	13-10-2000
			FI 20002261 A	13-10-2000
			WO 9305064 A1	18-03-1993
			GR 3034579 T3	31-01-2001
			HU 66097 A2	28-09-1994
			JP 2000038341 A	08-02-2000
			JP 7501515 T	16-02-1995
			JP 3219408 B2	15-10-2001
			JP 2000355542 A	26-12-2000
			JP 2000355598 A	26-12-2000
			KR 258396 B1	01-08-2000
LV 12618 A	20-02-2001			
LV 12618 B	20-07-2001			
NO 940635 A	29-04-1994			
NO 995075 A	29-04-1994			
NO 995076 A	29-04-1994			
NO 2595 A	29-04-1994			
SK 24694 A3	09-11-1994			

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/05169

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date		
WO 9305064	A		US 6011024 A	04-01-2000		
			US 6159960 A	12-12-2000		
			US 5616574 A	01-04-1997		
			US 6187766 B1	13-02-2001		
			US 5830886 A	03-11-1998		
			US 2001018435 A1	30-08-2001		
WO 9605216	A	22-02-1996	DE 4429397 A1	15-02-1996		
			AU 699701 B2	10-12-1998		
			AU 2974195 A	07-03-1996		
			BR 9508864 A	11-11-1997		
			CA 2196694 A1	22-02-1996		
			CN 1156998 A, B	13-08-1997		
			CZ 9700274 A3	13-08-1997		
			WO 9605216 A1	22-02-1996		
			EP 0775155 A1	28-05-1997		
			FI 970526 A	07-02-1997		
			HU 77610 A2	29-06-1998		
			JP 10503180 T	24-03-1998		
			NZ 289793 A	25-11-1998		
			PL 318525 A1	23-06-1997		
			RU 2139885 C1	20-10-1999		
			SG 47348 A1	17-04-1998		
			US 6080735 A	27-06-2000		
US 4792569	A	20-12-1988	NONE			
US 5025031	A	18-06-1991	NONE			
WO 9414827	A	07-07-1994	US 5384327 A	24-01-1995		
			AT 177107 T	15-03-1999		
			AU 691480 B2	21-05-1998		
			AU 5745894 A	19-07-1994		
			CA 2152486 A1	07-07-1994		
			DE 69323773 D1	08-04-1999		
			DE 69323773 T2	05-08-1999		
			DK 675893 T3	27-09-1999		
			EP 0675893 A1	11-10-1995		
			EP 0869131 A1	07-10-1998		
			ES 2130402 T3	01-07-1999		
			GR 3030242 T3	31-08-1999		
			JP 10506605 T	30-06-1998		
			WO 9414827 A1	07-07-1994		
			ZA 9309582 A	21-06-1995		
WO 9426702	A	24-11-1994	US 5491172 A	13-02-1996		
			AT 178891 T	15-04-1999		
			AU 681152 B2	21-08-1997		
			AU 6831194 A	12-12-1994		
			CA 2158268 A1	24-11-1994		
			CZ 9502966 A3	11-09-1996		
			DE 69417885 D1	20-05-1999		
			DE 69417885 T2	30-09-1999		
			DK 698010 T3	25-10-1999		
			EP 0698010 A1	28-02-1996		
			ES 2133163 T3	01-09-1999		
			FI 955438 A	10-11-1995		
			GR 3030356 T3	30-09-1999		

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/05169

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9426702	A	HU 72653 A2	28-05-1996
		JP 8510256 T	29-10-1996
		NO 954564 A	11-01-1996
		NZ 266689 A	24-11-1997
		RU 2137756 C1	20-09-1999
		SG 47056 A1	20-03-1998
		SK 139695 A3	06-11-1996
		WO 9426702 A1	24-11-1994
		US 5633287 A	27-05-1997
		ZA 9403313 A	13-11-1995
DE 1203042	B	NONE	
US 4513006	A	23-04-1985	
		AT 36149 T	15-08-1988
		AU 564842 B2	27-08-1987
		AU 3350484 A	04-04-1985
		CA 1241951 A1	13-09-1988
		DE 3473143 D1	08-09-1988
		DK 198191 A ,B,	09-12-1991
		DK 198291 A	09-12-1991
		DK 457784 A ,B,	27-03-1985
		EP 0138441 A2	24-04-1985
		ES 536225 D0	16-11-1985
		ES 8602634 A1	16-03-1986
		FI 843765 A ,B,	27-03-1985
		HU 36784 A2	28-10-1985
		IE 57684 B1	24-02-1993
		JP 1804249 C	26-11-1993
		JP 5005824 B	25-01-1993
		JP 60109558 A	15-06-1985
		JP 5331132 A	14-12-1993
		KR 9201775 B1	02-03-1992
MX 9202630 A1	30-06-1992		
NO 843836 A ,B,	27-03-1985		
NZ 209494 A	06-03-1987		
US 4582916 A	15-04-1986		
ZA 8407550 A	28-05-1986		
WO 0151055	A	19-07-2001	
		AU 2533101 A	24-07-2001
		WO 0151055 A2	19-07-2001
US 2001021707 A1	13-09-2001		

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05169

**A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**

IPK 7 A61K47/20 A61K31/565 A61K31/566 A61K31/568 A61K31/49  
A61K31/4045 A61P43/00

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A61K A61P

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data, BIOSIS, MEDLINE

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	BARTH A ET AL: "INFLUENCE OF SUBCHRONIC ADMINISTRATION OF OESTRADIOL, ETHINYLOESTRADIOL AND OESTRADIOL SULPHAMATE ON BILE FLOW, BILE ACID EXCRETION, AND LIVER AND BILIARY GLUTATHIONE STATUS IN RATS" ARCHIVES OF TOXICOLOGY, SPRINGER VERLAG, DE, Bd. 71, Nr. 7, 1997, Seiten 443-449, XP000986430	1-8, 11-13, 20, 23, 24
Y	ISSN: 0340-5761 Zusammenfassung	1-26
	--- -/--	

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

14. Januar 2002

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

23/01/2002

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Herrera, S

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	ELGER W ET AL: "SULFAMATES OF VARIOUS ESTROGENS ARE PRODRUGS WITH INCREASED SYSTEMIC AND REDUCED HEPATIC ESTROGENICITY AT ORAL APPLICATION" JOURNAL OF STEROID BIOCHEMISTRY AND MOLECULAR BIOLOGY, ELSEVIER SCIENCE LTD., OXFORD, GB, Bd. 55, Nr. 3/4, 1995, Seiten 395-403, XP000618892 ISSN: 0960-0760	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	Zusammenfassung ----	1-26
X	WO 97 14712 A (JENAPHARM GMBH) 24. April 1997 (1997-04-24)	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	Ansprüche ----	1-26
X	WO 00 06475 A (HARTLEPP KARL HEINZ ;BRUUN BRIAN (DK); CRISPLANT AS (DK); MATANIN) 10. Februar 2000 (2000-02-10)	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	Ansprüche ----	1-26
X	WO 93 05064 A (IMPERIAL COLLEGE) 18. März 1993 (1993-03-18)	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	Ansprüche ----	1-26
X	WO 96 05216 A (JENAPHARM GMBH ;SIEMANN CHRISTEL & HF (DE); SCHWARZ SIGFRID (DE);) 22. Februar 1996 (1996-02-22)	1-8, 11-13, 20,23,24
Y	Ansprüche ----	1-26
X	US 4 792 569 A (MARYANOFF BRUCE E ET AL) 20. Dezember 1988 (1988-12-20)	1-8,11, 12
Y	Ansprüche ----	
X	US 5 025 031 A (LO YOUNG S ET AL) 18. Juni 1991 (1991-06-18)	1-8,11, 12
Y	Ansprüche ----	
X	WO 94 14827 A (MCNEILAB INC) 7. Juli 1994 (1994-07-07)	1-8,11, 12
Y	Ansprüche ----	
X	WO 94 26702 A (WARNER LAMBERT CO) 24. November 1994 (1994-11-24)	1-8,11, 12
Y	Ansprüche ----	
	----	
	-/--	

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	MARYANOFF B E ET AL: "ANTICONVULSANT SUGAR SULFAMATES. POTENT CYCLIC SULFATE AND CYCLIC SULFITE ANALOGUES OF TOPIRAMATE" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, OXFORD, GB, Bd. 3, Nr. 12, 1993, Seiten 2653-2656, XP000914306 ISSN: 0960-894X das ganze Dokument ---	1-8, 11-13
X	DE 12 03 042 B (SCHERING AG) das ganze Dokument ---	1-9
X	US 4 513 006 A (MARYANOFF BRUCE E ET AL) 23. April 1985 (1985-04-23) Ansprüche ---	1-7,11, 12
E	WO 01 51055 A (PROSKE HENRICH THOMAS ;SCHERING AG (DE); ELGER WALTER (DE); RODDER) 19. Juli 2001 (2001-07-19) Seite 9, Zeile 28 -Seite 10, Zeile 3; Ansprüche 1-26 -----	1-8, 11-13, 20,23,24

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Die geltenden Patentansprüche beziehen sich auf eine unverhältnismäßig große Zahl möglicher Verbindungen/Produkte/Vorrichtung/Verfahren, von denen sich nur ein kleiner Anteil im Sinne von Art. 6 PCT auf die Beschreibung stützen und/oder als im Sinne von Art.5 PCT in der Patentanmeldung offenbart gelten kann. Im vorliegenden Fall fehlt den Patentansprüchen die entsprechende Stütze und fehlt der Patentanmeldung die nötige Offenbarung in einem solchen Maße, daß eine sinnvolle Recherche über den gesamten erstrebten Schutzbereich unmöglich erscheint. Daher wurde die Recherche auf die Teile der Patentansprüche gerichtet, welche im o.a. Sinne als gestützt und offenbart erscheinen, nämlich die Teile betreffend, die Verbindungen worin das Wirkstoff wie in den Ansprüchen 10 und 20 bis 26 definiert ist.

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, daß Patentansprüche, oder Teile von Patentansprüchen, auf Erfindungen, für die kein internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, normalerweise nicht Gegenstand einer internationalen vorläufigen Prüfung sein können (Regel 66.1(e) PCT). In seiner Eigenschaft als mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde wird das EPA also in der Regel keine vorläufige Prüfung für Gegenstände durchführen, zu denen keine Recherche vorliegt. Dies gilt auch für den Fall, daß die Patentansprüche nach Erhalt des internationalen Recherchenberichtes geändert wurden (Art. 19 PCT), oder für den Fall, daß der Anmelder im Zuge des Verfahrens gemäß Kapitel II PCT neue Patentansprüche vorlegt.

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichung ..., die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05169

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9714712 A	24-04-1997	DE 19540233 A1	24-04-1997
		AT 178903 T	15-04-1999
		AU 1436097 A	07-05-1997
		BR 9610905 A	13-07-1999
		CN 1200126 A	25-11-1998
		WO 9714712 A2	24-04-1997
		DE 59601683 D1	20-05-1999
		EP 0862577 A2	09-09-1998
		ES 2131972 T3	01-08-1999
		GR 3030733 T3	30-11-1999
		JP 11505268 T	18-05-1999
		US 5705495 A	06-01-1998
		WO 0006475 A	10-02-2000
WO 0006475 A1	10-02-2000		
EP 1100736 A1	23-05-2001		
US 6259967 B1	10-07-2001		
WO 9305064 A	18-03-1993	AT 194843 T	15-08-2000
		AU 717116 B2	16-03-2000
		AU 1007799 A	04-03-1999
		AU 668882 B2	23-05-1996
		AU 2490592 A	05-04-1993
		AU 689043 B2	19-03-1998
		AU 5837396 A	05-09-1996
		AU 7195298 A	13-08-1998
		BR 9206434 A	27-09-1994
		CA 2114630 A1	18-03-1993
		CZ 9400440 A3	18-01-1995
		DE 69231280 D1	24-08-2000
		DE 69231280 T2	30-11-2000
		DK 641355 T3	09-10-2000
		EP 1099706 A2	16-05-2001
		EP 0641355 A1	08-03-1995
		EP 0928609 A2	14-07-1999
		EP 0921130 A2	09-06-1999
		EP 0982032 A2	01-03-2000
		ES 2148178 T3	16-10-2000
		FI 940903 A	20-04-1994
		FI 20002259 A	13-10-2000
		FI 20002260 A	13-10-2000
		FI 20002261 A	13-10-2000
		WO 9305064 A1	18-03-1993
		GR 3034579 T3	31-01-2001
		HU 66097 A2	28-09-1994
		JP 2000038341 A	08-02-2000
		JP 7501515 T	16-02-1995
		JP 3219408 B2	15-10-2001
		JP 2000355542 A	26-12-2000
		JP 2000355598 A	26-12-2000
		KR 258396 B1	01-08-2000
		LV 12618 A	20-02-2001
		LV 12618 B	20-07-2001
		NO 940635 A	29-04-1994
NO 995075 A	29-04-1994		
NO 995076 A	29-04-1994		
NO 2595 A	29-04-1994		
SK 24694 A3	09-11-1994		

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05169

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	
WO 9305064	A	US 6011024	04-01-2000	
		US 6159960	12-12-2000	
		US 5616574	01-04-1997	
		US 6187766	13-02-2001	
		US 5830886	03-11-1998	
		US 2001018435	30-08-2001	
WO 9605216	A	22-02-1996	DE 4429397	15-02-1996
		AU 699701	10-12-1998	
		AU 2974195	07-03-1996	
		BR 9508864	11-11-1997	
		CA 2196694	22-02-1996	
		CN 1156998	13-08-1997	
		CZ 9700274	13-08-1997	
		WO 9605216	22-02-1996	
		EP 0775155	28-05-1997	
		FI 970526	07-02-1997	
		HU 77610	29-06-1998	
		JP 10503180	24-03-1998	
		NZ 289793	25-11-1998	
		PL 318525	23-06-1997	
		RU 2139885	20-10-1999	
		SG 47348	17-04-1998	
US 6080735	27-06-2000			
US 4792569	A	20-12-1988	KEINE	
US 5025031	A	18-06-1991	KEINE	
WO 9414827	A	07-07-1994	US 5384327	24-01-1995
		AT 177107	15-03-1999	
		AU 691480	21-05-1998	
		AU 5745894	19-07-1994	
		CA 2152486	07-07-1994	
		DE 69323773	08-04-1999	
		DE 69323773	05-08-1999	
		DK 675893	27-09-1999	
		EP 0675893	11-10-1995	
		EP 0869131	07-10-1998	
		ES 2130402	01-07-1999	
		GR 3030242	31-08-1999	
		JP 10506605	30-06-1998	
		WO 9414827	07-07-1994	
ZA 9309582	21-06-1995			
WO 9426702	A	24-11-1994	US 5491172	13-02-1996
		AT 178891	15-04-1999	
		AU 681152	21-08-1997	
		AU 6831194	12-12-1994	
		CA 2158268	24-11-1994	
		CZ 9502966	11-09-1996	
		DE 69417885	20-05-1999	
		DE 69417885	30-09-1999	
		DK 698010	25-10-1999	
		EP 0698010	28-02-1996	
		ES 2133163	01-09-1999	
		FI 955438	10-11-1995	
		GR 3030356	30-09-1999	

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichung..., die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05169

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	
WO 9426702	A	HU 72653 A2	28-05-1996	
		JP 8510256 T	29-10-1996	
		NO 954564 A	11-01-1996	
		NZ 266689 A	24-11-1997	
		RU 2137756 C1	20-09-1999	
		SG 47056 A1	20-03-1998	
		SK 139695 A3	06-11-1996	
		WO 9426702 A1	24-11-1994	
		US 5633287 A	27-05-1997	
		ZA 9403313 A	13-11-1995	
-----				
DE 1203042	B	KEINE		
-----				
US 4513006	A	23-04-1985	AT 36149 T	15-08-1988
			AU 564842 B2	27-08-1987
			AU 3350484 A	04-04-1985
			CA 1241951 A1	13-09-1988
			DE 3473143 D1	08-09-1988
			DK 198191 A ,B,	09-12-1991
			DK 198291 A	09-12-1991
			DK 457784 A ,B,	27-03-1985
			EP 0138441 A2	24-04-1985
			ES 536225 D0	16-11-1985
			ES 8602634 A1	16-03-1986
			FI 843765 A ,B,	27-03-1985
			HU 36784 A2	28-10-1985
			IE 57684 B1	24-02-1993
			JP 1804249 C	26-11-1993
			JP 5005824 B	25-01-1993
			JP 60109558 A	15-06-1985
			JP 5331132 A	14-12-1993
			KR 9201775 B1	02-03-1992
			MX 9202630 A1	30-06-1992
NO 843836 A ,B,	27-03-1985			
NZ 209494 A	06-03-1987			
US 4582916 A	15-04-1986			
ZA 8407550 A	28-05-1986			
-----				
WO 0151055	A	19-07-2001	AU 2533101 A	24-07-2001
			WO 0151055 A2	19-07-2001
			US 2001021707 A1	13-09-2001
-----				