

(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  
15. Februar 2001 (15.02.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 01/10425 A3**

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **A61K 31/495**, 31/445, 31/505, 31/55, 31/54, A61P 15/12
- (74) **Anwalt: LAUDIEN, Dieter**; Boehringer Ingelheim GmbH, B Patente, 55216 Ingelheim am Rhein (DE).
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/07613
- (81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, 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, MZ, 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.
- (22) Internationales Anmeldedatum:  
5. August 2000 (05.08.2000)
- (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), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (30) **Angaben zur Priorität:**  
199 37 304.3 10. August 1999 (10.08.1999) DE
- (71) **Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA KG** [DE/DE]; 55216 Ingelheim am Rhein (DE).
- (72) **Erfinder; und**
- (75) **Erfinder/Anmelder (nur für US): DOODS, Henri** [NL/DE]; Freiherr-von-König-Strasse 6, 88447 Warthausen (DE). **RUDOLF, Klaus** [DE/DE]; Öschweg 11, 88447 Warthausen (DE). **EBERLEIN, Wolfgang** [DE/DE]; Obere Au 6, 88400 Biberach (DE). **ENGEL, Wolfhard** [DE/DE]; Mozartstrasse 13, 88400 Biberach (DE).
- (88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:** 7. Februar 2002
- 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:** USE OF CGRP ANTAGONISTS AND CGRP RELEASE INHIBITORS FOR CONTROLLING MENOPAUSAL HOT FLASHES

(54) **Bezeichnung:** VERWENDUNG VON CGRP-ANTAGONISTEN UND CGRP-RELEASE-HEMMERN ZUR BEKÄMPFUNG MENOPAUSALER HITZEWALLUNGEN

(57) **Abstract:** The invention relates to the use of CGRP antagonists and CGRP release inhibitors for controlling menopausal hot flashes, to corresponding medicaments containing, as an active substance, one or more CGRP antagonists and/or CGRP release inhibitors, and to the production thereof.

(57) **Zusammenfassung:** Die Erfindung betrifft die Verwendung von CGRP-Antagonisten und CGRP-Release-Hemmern zur Bekämpfung menopausaler Hitzewallungen sowie entsprechende Arzneimittel, enthaltend als Wirkstoff einen oder mehrere CGRP-Antagonisten oder/und CGRP-Release-Hemmer, und deren Herstellung.



WO 01/10425 A3

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 00/07613

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

IPC 7 A61K31/495 A61K31/445 A61K31/505 A61K31/55 A61K31/54  
A61P15/12

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

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, BIOSIS, EMBASE, SCISEARCH, CHEM ABS Data, MEDLINE

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 98 11128 A (EBERLEIN WOLFGANG ; ENTZEROTH MICHAEL (DE); HALLERMAYER GERHARD (DE) 19 March 1998 (1998-03-19)	10
A	claims 1,8 page 66 -page 136	1-9
E	DE 199 11 039 A (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA) 14 September 2000 (2000-09-14) page 7, line 11 -page 8, line 20 page 12, line 37 - line 60	10
A	US 5 910 482 A (WIMALAWANSA SUNIL J ET AL) 8 June 1999 (1999-06-08) column 1, line 9 - line 22 column 1, line 60 -column 2, line 5	1-10
	-/--	



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.
- \*G\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 September 2001

Date of mailing of the international search report

05/10/2001

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

Bonzano, C

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 00/07613

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 821 061 A (SMITHKLINE BEECHAM CORP ;MEDIMMUNE INC (US)) 28 January 1998 (1998-01-28) page 3, line 34 - line 44 ---	1-10
P,X	DOODS: "pharmacological profile..." BR. J. PHARMACOL., vol. 129, no. 3, 2000, pages 420-423, XP000992559 page 420, column 2, paragraph 1 page 423, column 2, paragraph 2 -----	10

Additional matter PCT/ISA/210

Continuation of Field I.2

Relevant Patent Claims Nos. 1-4, 6-9 relate to a compound respectively characterized by a worthwhile peculiarity or quality, namely the activity as CGRP antagonists and CGRP release inhibitors.

The patent claims thus comprise all products, etc., which have this peculiarity or quality, whereas the description of the patent application provides support for only a limited number of such products, etc. under the terms of PCT Article 5. In the case in question, the patent claims lack the corresponding support or the patent application lacks the necessary disclosure to such a degree that a meaningful search appears to be impossible to conduct with respect to the entire scope for which protection is sought. Nevertheless, the patent claims also lack the clarity required in PCT Article 6, whereby an attempt was made to define the compound in terms of the respectively desired outcome. In addition, this absence of clarity is such that it makes it impossible to conduct a meaningful search with respect to the entire scope for which protection is sought. For this reason, the search was directed at the portions of the patent claims, which can be regarded as supported and disclosed in the above-mentioned sense, namely at the portions relating to the products as cited in Claim No. 5.

Claims completely searched: 5, 10.

Claims incompletely searched: 1-4, 6-9

The applicant is therefore advised that patent claims or sections of patent claims laid to inventions for which no international search report was drafted normally cannot be the subject of an international preliminary examination (PCT Rule 66.1(e)). Similar to the authority entrusted with the task of carrying out the international preliminary examination, the EPO also does not generally carry out a preliminary examination of subject matter for which no search has been conducted. This is also valid in the case when the patent claims have been amended after receipt of the international search report (PCT Article 19), or in the case when the applicant submits new patent claims pursuant to the procedure in accordance with PCT Chapter II.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 00/07613

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date	
WO 9811128	A	19-03-1998	DE 19636623 A1	12-03-1998
			DE 19720011 A1	19-11-1998
			AU 721035 B2	22-06-2000
			AU 4119697 A	02-04-1998
			BG 103250 A	31-05-2000
			BR 9712023 A	31-08-1999
			CN 1230196 A	29-09-1999
			CZ 9900823 A3	16-06-1999
			EE 9900115 A	15-10-1999
			WO 9811128 A1	19-03-1998
			EP 0927192 A1	07-07-1999
			HR 970481 A1	31-08-1998
			JP 2000505100 T	25-04-2000
			NO 991130 A	05-05-1999
			PL 331989 A1	16-08-1999
			SK 29799 A3	13-03-2000
			TR 9900537 T2	21-07-1999
HU 9904501 A2	28-04-2000			
-----				
DE 19911039	A	14-09-2000	DE 19911039 A1	14-09-2000
			AU 4288000 A	04-10-2000
			WO 0055154 A1	21-09-2000
-----				
US 5910482	A	08-06-1999	AU 2657897 A	10-10-1997
			EP 0896581 A1	17-02-1999
			WO 9734922 A1	25-09-1997
-----				
EP 0821061	A	28-01-1998	US 5710024 A	20-01-1998
			EP 0821061 A2	28-01-1998
			JP 10201482 A	04-08-1998
-----				

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/07613

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 A61K31/495 A61K31/445 A61K31/505 A61K31/55 A61K31/54  
A61P15/12

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

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A61K

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, BIOSIS, EMBASE, SCISEARCH, CHEM ABS Data, MEDLINE

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 98 11128 A (EBERLEIN WOLFGANG ; ENTZEROTH MICHAEL (DE); HALLERMAYER GERHARD (DE) 19. März 1998 (1998-03-19)	10
A	Ansprüche 1,8 Seite 66 -Seite 136 ---	1-9
E	DE 199 11 039 A (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA) 14. September 2000 (2000-09-14) Seite 7, Zeile 11 -Seite 8, Zeile 20 Seite 12, Zeile 37 - Zeile 60 ---	10
A	US 5 910 482 A (WIMALAWANSA SUNIL J ET AL) 8. Juni 1999 (1999-06-08) Spalte 1, Zeile 9 - Zeile 22 Spalte 1, Zeile 60 -Spalte 2, Zeile 5 ---	1-10
	-/--	

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

27. September 2001

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

05/10/2001

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Bonzano, C

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Int. tionales Aktenzeichen

PCT/EP 00/07613

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 821 061 A (SMITHKLINE BEECHAM CORP ;MEDIMMUNE INC (US)) 28. Januar 1998 (1998-01-28) Seite 3, Zeile 34 - Zeile 44 ---	1-10
P,X	DOODS: "pharmacological profile..." BR. J. PHARMACOL., Bd. 129, Nr. 3, 2000, Seiten 420-423, XP000992559 Seite 420, Spalte 2, Absatz 1 Seite 423, Spalte 2, Absatz 2 -----	10

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Die geltenden Patentansprüche 1-4,6-9 beziehen sich auf eine Verbindung, jeweils charakterisiert durch eine erstrebenswerte Eigenheit oder Eigenschaft, nämlich die Aktivität als CGRP-ANTAGONISTEN und CGRP-RELEASE-HEMMERN.

Die Patentansprüche umfassen daher alle Produkte etc., die diese Eigenheit oder Eigenschaft aufweisen, wohingegen die Patentanmeldung Stütze durch die Beschreibung im Sinne von Art. 5 PCT nur für eine begrenzte Zahl solcher Produkte etc. liefert. Im vorliegenden Fall fehlen den Patentansprüchen die entsprechende Stütze bzw. der Patentanmeldung die nötige Offenbarung in einem solchen Maße, daß eine sinnvolle Recherche über den gesamten erstrebten Schutzbereich unmöglich erscheint. Desungeachtet fehlt den Patentansprüchen auch die in Art. 6 PCT geforderte Klarheit, nachdem in ihnen versucht wird, die Verbindung über das jeweils erstrebte Ergebnis zu definieren. Auch dieser Mangel an Klarheit ist dergestalt, daß er eine sinnvolle Recherche über den gesamten erstrebten Schutzbereich unmöglich macht. Daher wurde die Recherche auf die Teile der Patentansprüche gerichtet, welche im o.a. Sinne als klar, gestützt oder offenbart erscheinen, nämlich die Teile betreffend die Produkte wie in der Anspruch 5 angegeben.

Ansprüche völlig gesucht: 5,10.

Ansprüche unvollig gesucht: 1-4,6-9.

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 Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP 00/07613

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9811128	A	19-03-1998	DE 19636623 A1	12-03-1998
			DE 19720011 A1	19-11-1998
			AU 721035 B2	22-06-2000
			AU 4119697 A	02-04-1998
			BG 103250 A	31-05-2000
			BR 9712023 A	31-08-1999
			CN 1230196 A	29-09-1999
			CZ 9900823 A3	16-06-1999
			EE 9900115 A	15-10-1999
			WO 9811128 A1	19-03-1998
			EP 0927192 A1	07-07-1999
			HR 970481 A1	31-08-1998
			JP 2000505100 T	25-04-2000
			NO 991130 A	05-05-1999
			PL 331989 A1	16-08-1999
			SK 29799 A3	13-03-2000
			TR 9900537 T2	21-07-1999
			HU 9904501 A2	28-04-2000
-----				
DE 19911039	A	14-09-2000	DE 19911039 A1	14-09-2000
			AU 4288000 A	04-10-2000
			WO 0055154 A1	21-09-2000
-----				
US 5910482	A	08-06-1999	AU 2657897 A	10-10-1997
			EP 0896581 A1	17-02-1999
			WO 9734922 A1	25-09-1997
-----				
EP 0821061	A	28-01-1998	US 5710024 A	20-01-1998
			EP 0821061 A2	28-01-1998
			JP 10201482 A	04-08-1998
-----				