

(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
20. Februar 2003 (20.02.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/013530 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/47,
31/4738, C07D 221/16, 215/48, 491/04, 221/18, A61P
25/04

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/08729

(22) Internationales Anmeldedatum:
5. August 2002 (05.08.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 37 488.7 3. August 2001 (03.08.2001) DE

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, 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, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

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

(71) Anmelder (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): GRÜNENTHAL GMBH [DE/DE]; Zieglerstrasse 6, 52078 Aachen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): SUNDERMANN, Corinna [DE/DE]; Oppenhoffallee 83-85, 52066 Aachen (DE). PRZEWOSNY, Michael [DE/DE]; Suermondtplatz 3, 52062 Aachen (DE). ENGLBERGER, Werner, Günter [DE/DE]; Sonnenweg 1, 52223 Stolberg (DE).

Veröffentlicht:

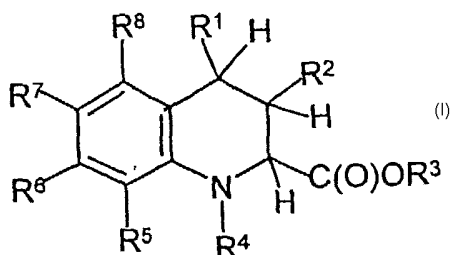
— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts: 25. September 2003

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: SALTS OF SUBSTITUTED 1, 2, 3, 4-TETRAHYDROQUINOLINE-2-CARBOXYLIC ACID DERIVATIVES AS NMDA ANTAGONISTS

(54) Bezeichnung: SALZE SUBSTITUIERTER 1,2,3,4,-TETRAHYDROCHINOLIN-2-CARBONSAUREDERIVATE ALS NMDA-ANTAGONISTEN



(57) Abstract: The invention relates to salts of substituted 1, 2, 3, 4-tetrahydroquinoline-2-carboxylic acid derivatives of formula (I), in addition to methods for the production thereof, the use thereof in the production of medicaments and medicaments containing said compounds.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Salze substituierter 1,2,3,4-Tetrahydrochinolin-2-carbonsäurederivate der allgemeinen Formel I, sowie Verfahren zu deren Herstellung, deren Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln und Arzneimittel enthaltend diese Verbindungen.(I)

WO 03/013530 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 02/08729

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 IPC 7 A61K31/47 A61K31/4738 C07D221/16 C07D215/48 C07D491/04
 C07D221/18 A61P25/04

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 C07D

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, BEILSTEIN Data

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 34111 A (TREGA BIOSCIENCES INC) 6 August 1998 (1998-08-06) cited in the application page 58, line 8 - line 18; claims 1,3 page 69, line 5; figure 1 page 96, line 14; figure 3 page 48, line 10 - line 11 ---	1-6,9-23
X	WO 99 64411 A (FABIO ROMANO DI ;GLAXO WELLCOME SPA (IT)) 16 December 1999 (1999-12-16) page 6, line 1 - line 4; claim 1; examples 1,2,14-19 page 10, line 16 -page 11, line 4 page 11, line 33 -page 12, line 8 page 62, line 32 -page 63, line 17 --- -/--	1-5,7-23

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	"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
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"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
"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)	"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.
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 16 January 2003	Date of mailing of the international search report 17 01 03
---	---

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 Seymour, L
--	---

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 02/08729

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	WO 01 58875 A (BLOMS FUNKE PETRA ;ENGLBERGER WERNER (DE); JAGUSCH UTZ PETER (DE);) 16 August 2001 (2001-08-16) Beispiele claims 1,22-25 ---	1-23
X	WO 98 34115 A (TREGA BIOSCIENCES INC) 6 August 1998 (1998-08-06) page 57, line 14 - line 23; claim 1 page 48, line 12 - line 13; figures 1,2 ---	1-5,7-23
X	EP 0 386 839 A (MERCK SHARP & DOHME) 12 September 1990 (1990-09-12) cited in the application page 2, line 1 - line 7; claim 1 Beispiele ---	1-5,7-23
X	US 4 898 854 A (HUTCHISON ALAN J ET AL) 6 February 1990 (1990-02-06) column 1, line 58 - line 68 column 4, line 10 - line 34; examples 9-11 ---	1-5,7-23
X	CARLING R W ET AL: "2-CARBOXYTETRAHYDROQUINOLINES. CONFORMATIONAL AND STEREOCHEMICAL REQUIREMENTS FOR ANTAGONISM OF THE GLYCINE SITE ON THE NMDA RECEPTOR" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, WASHINGTON, US, vol. 35, 1992, pages 1942-1953, XP001002472 ISSN: 0022-2623 cited in the application the whole document ---	1-5,7-23
X	LEESON P D ET AL: "4-AMIDO-2-CARBOXYTETRAHYDROQUINOLINE. STRUCTURE-ACTIVITY RELATIONSHIPS FOR ANTAGONISM AT THE GLYCINE SITE OF THE NMDA RECEPTOR" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, WASHINGTON, US, vol. 36, no. 11, 1992, pages 1954-1968, XP000919439 ISSN: 0022-2623 cited in the application the whole document -----	1-5,7-23

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/08729

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9834111	A	06-08-1998	US 5925527 A	20-07-1999
			AU 5592898 A	25-08-1998
			EP 0983507 A1	08-03-2000
			NZ 337046 A	28-01-2000
			WO 9834111 A1	06-08-1998

WO 9964411	A	16-12-1999	AU 753867 B2	31-10-2002
			AU 4509299 A	30-12-1999
			BG 105123 A	30-11-2001
			BR 9911145 A	06-03-2001
			CA 2334727 A1	16-12-1999
			CN 1311785 T	05-09-2001
			EE 200000733 A	17-06-2002
			WO 9964411 A1	16-12-1999
			EP 1086093 A1	28-03-2001
			HR 20000845 A1	31-10-2001
			HU 0102767 A2	28-12-2001
			JP 2002517492 T	18-06-2002
			NO 20006227 A	08-02-2001
			PL 344694 A1	19-11-2001
			TR 200003652 T2	20-04-2001
			US 2002169186 A1	14-11-2002
			US 6362199 B1	26-03-2002
US 2002052391 A1	02-05-2002			
ZA 200007225 A	06-03-2002			

WO 0158875	A	16-08-2001	DE 10005302 A1	17-01-2002
			AU 2679401 A	20-08-2001
			WO 0158875 A2	16-08-2001
			EP 1254118 A2	06-11-2002

WO 9834115	A	06-08-1998	AU 8191998 A	25-08-1998
			EP 0977989 A1	09-02-2000
			WO 9834115 A1	06-08-1998

EP 0386839	A	12-09-1990	AT 147732 T	15-02-1997
			AU 5114490 A	13-09-1990
			CA 2011686 A1	08-09-1990
			DE 69029668 D1	27-02-1997
			DE 69029668 T2	07-08-1997
			EP 0386839 A2	12-09-1990
			JP 3034969 A	14-02-1991
			NO 901082 A	10-09-1990
			PT 93362 A	07-11-1990
			US 5231102 A	27-07-1993
			ZA 9001706 A	27-02-1991

US 4898854	A	06-02-1990	AT 63560 T	15-06-1991
			AU 593553 B2	15-02-1990
			AU 5784686 A	27-11-1986
			CA 1312331 A1	05-01-1993
			CY 1769 A	20-10-1995
			DD 261164 A5	19-10-1988
			DE 3679236 D1	20-06-1991
			DK 242786 A	25-11-1986
			EP 0203891 A2	03-12-1986
			ES 8707250 A1	01-10-1987
			FI 862093 A ,B,	25-11-1986

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP02/08729

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

SEE ADDITIONAL SHEET FURTHER INFORMATION
PCT/ISA/210

3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

SEE ADDITIONAL SHEET

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
 No protest accompanied the payment of additional search fees.

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, namely

1. Claims 1-5 (in part); 6; 9-23 (in part)

compounds of Formula I wherein R1 and R2 together form a ring, and corresponding preparations, compositions and uses.

2. Claims 1-5; 7; 8; 9-23 (in part)

compounds of Formula I wherein R1 and R2 together do not form a ring, and corresponding preparations, compositions and uses.

Continuation of I.2

The search for the second invention initially yielded a very large number of documents detrimental to novelty. This number is so large that it becomes impossible to determine a subject matter in any of the claims for which protection might justifiably be sought (PCT Article 6). For these reasons a meaningful search covering the full scope of the claims appears impossible. The search was therefore limited to the claimed structure in combination with the use in the treatment for pain (cf. present description, page 1, line 11).

The applicant is advised that claims or parts of claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established normally cannot be the subject of an international preliminary examination (PCT Rule 66.1(e)). In its capacity as International Preliminary Examining Authority the EPO generally will not carry out a preliminary examination for subjects that have not been searched. This also applies to cases where the claims were amended after receipt of the international search report (PCT Article 19) or where the applicant submits new claims in the course of the procedure under PCT Chapter II.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/08729

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 4898854	A	GR 861337 A1	23-09-1986
		HK 9994 A	09-02-1994
		HU 41041 A2	30-03-1987
		IE 58440 B1	22-09-1993
		JP 1935834 C	26-05-1995
		JP 6053752 B	20-07-1994
		JP 62026289 A	04-02-1987
		KR 9410292 B1	22-10-1994
		NO 862064 A ,B,	25-11-1986
		NZ 216282 A	29-09-1988
		PH 23848 A	23-11-1989
		PT 82626 A ,B	01-06-1986
		SG 136193 G	31-03-1994
		US 4906621 A	06-03-1990
		US 5057506 A	15-10-1991
		US 5217963 A	08-06-1993
		ZA 8603826 A	28-01-1987
		AT 60776 T	15-02-1991
		AU 610841 B2	30-05-1991
		AU 8145587 A	26-05-1988
		CA 1312608 A1	12-01-1993
		DD 273837 A5	29-11-1989
		DE 3768000 D1	14-03-1991
		DK 609487 A	22-05-1988
		EP 0275820 A2	27-07-1988
		ES 2031927 T3	01-01-1993
		FI 875097 A ,B,	22-05-1988
		GR 3001443 T3	25-09-1992
		HU 46331 A2	28-10-1988
		IE 60534 B1	27-07-1994
		JP 1135791 A	29-05-1989
		JP 1959482 C	10-08-1995
		JP 6086470 B	02-11-1994
		MX 9437 A	31-01-1994
		NO 874854 A ,B,	24-05-1988
		NZ 222607 A	26-10-1990
		PH 25465 A	01-07-1991
		PT 86168 A ,B	01-12-1987
		ZA 8708699 A	23-05-1988

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/08729

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 A61K31/47 A61K31/4738 C07D221/16 C07D215/48 C07D491/04
C07D221/18 A61P25/04

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D

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, BEILSTEIN Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 98 34111 A (TREGA BIOSCIENCES INC) 6. August 1998 (1998-08-06) in der Anmeldung erwähnt Seite 58, Zeile 8 - Zeile 18; Ansprüche 1,3 Seite 69, Zeile 5; Abbildung 1 Seite 96, Zeile 14; Abbildung 3 Seite 48, Zeile 10 - Zeile 11 ---	1-6,9-23
X	WO 99 64411 A (FABIO ROMANO DI ;GLAXO WELLCOME SPA (IT)) 16. Dezember 1999 (1999-12-16) Seite 6, Zeile 1 - Zeile 4; Anspruch 1; Beispiele 1,2,14-19 Seite 10, Zeile 16 -Seite 11, Zeile 4 Seite 11, Zeile 33 -Seite 12, Zeile 8 Seite 62, Zeile 32 -Seite 63, Zeile 17 --- -/--	1-5,7-23

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

16. Januar 2003

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

127 01 03

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

Seymour, L

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie ^o	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, X	WO 01 58875 A (BLOMS FUNKE PETRA ;ENGLBERGER WERNER (DE); JAGUSCH UTZ PETER (DE);) 16. August 2001 (2001-08-16) Beispiele Ansprüche 1,22-25 ----	1-23
X	WO 98 34115 A (TREGA BIOSCIENCES INC) 6. August 1998 (1998-08-06) Seite 57, Zeile 14 - Zeile 23; Anspruch 1 Seite 48, Zeile 12 - Zeile 13; Abbildungen 1,2 ----	1-5,7-23
X	EP 0 386 839 A (MERCK SHARP & DOHME) 12. September 1990 (1990-09-12) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 1 - Zeile 7; Anspruch 1 Beispiele ----	1-5,7-23
X	US 4 898 854 A (HUTCHISON ALAN J ET AL) 6. Februar 1990 (1990-02-06) Spalte 1, Zeile 58 - Zeile 68 Spalte 4, Zeile 10 - Zeile 34; Beispiele 9-11 ----	1-5,7-23
X	CARLING R W ET AL: "2-CARBOXYTETRAHYDROQUINOLINES. CONFORMATIONAL AND STEREOCHEMICAL REQUIREMENTS FOR ANTAGONISM OF THE GLYCINE SITE ON THE NMDA RECEPTOR" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY. WASHINGTON, US, Bd. 35, 1992, Seiten 1942-1953, XP001002472 ISSN: 0022-2623 in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument ----	1-5,7-23
X	LEESON P D ET AL: "4-AMIDO-2-CARBOXYTETRAHYDROQUINOLINE. STRUCTURE-ACTIVITY RELATIONSHIPS FOR ANTAGONISM AT THE GLYCINE SITE OF THE NMDA RECEPTOR" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY. WASHINGTON, US, Bd. 36, Nr. 11, 1992, Seiten 1954-1968, XP000919439 ISSN: 0022-2623 in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	1-5,7-23

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/08729

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung			
WO 9834111	A	06-08-1998	US 5925527 A	20-07-1999			
			AU 5592898 A	25-08-1998			
			EP 0983507 A1	08-03-2000			
			NZ 337046 A	28-01-2000			
			WO 9834111 A1	06-08-1998			
WO 9964411	A	16-12-1999	AU 753867 B2	31-10-2002			
			AU 4509299 A	30-12-1999			
			BG 105123 A	30-11-2001			
			BR 9911145 A	06-03-2001			
			CA 2334727 A1	16-12-1999			
			CN 1311785 T	05-09-2001			
			EE 200000733 A	17-06-2002			
			WO 9964411 A1	16-12-1999			
			EP 1086093 A1	28-03-2001			
			HR 20000845 A1	31-10-2001			
			HU 0102767 A2	28-12-2001			
			JP 2002517492 T	18-06-2002			
			NO 20006227 A	08-02-2001			
			PL 344694 A1	19-11-2001			
			TR 200003652 T2	20-04-2001			
			US 2002169186 A1	14-11-2002			
			US 6362199 B1	26-03-2002			
			US 2002052391 A1	02-05-2002			
			ZA 200007225 A	06-03-2002			
WO 0158875	A	16-08-2001	DE 10005302 A1	17-01-2002			
			AU 2679401 A	20-08-2001			
			WO 0158875 A2	16-08-2001			
			EP 1254118 A2	06-11-2002			
WO 9834115	A	06-08-1998	AU 8191998 A	25-08-1998			
			EP 0977989 A1	09-02-2000			
			WO 9834115 A1	06-08-1998			
EP 0386839	A	12-09-1990	AT 147732 T	15-02-1997			
			AU 5114490 A	13-09-1990			
			CA 2011686 A1	08-09-1990			
			DE 69029668 D1	27-02-1997			
			DE 69029668 T2	07-08-1997			
			EP 0386839 A2	12-09-1990			
			JP 3034969 A	14-02-1991			
			NO 901082 A	10-09-1990			
			PT 93362 A	07-11-1990			
			US 5231102 A	27-07-1993			
			ZA 9001706 A	27-02-1991			
			US 4898854	A	06-02-1990	AT 63560 T	15-06-1991
						AU 593553 B2	15-02-1990
AU 5784686 A	27-11-1986						
CA 1312331 A1	05-01-1993						
CY 1769 A	20-10-1995						
DD 261164 A5	19-10-1988						
DE 3679236 D1	20-06-1991						
DK 242786 A	25-11-1986						
EP 0203891 A2	03-12-1986						
ES 8707250 A1	01-10-1987						
FI 862093 A ,B,	25-11-1986						

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 02/08729

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. Ansprüche Nr. _____
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich

2. Ansprüche Nr. _____
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
siehe Zusatzblatt WEITERE ANGABEN PCT/ISA/210

3. Ansprüche Nr. _____
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese Internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.

2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.

3. Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr. _____

4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
- Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-5 (jeweils teilweise); 6; 9-23 (jeweils teilweise)

Verbindungen der Formel I worin R1 und R2 zusammen einen Ring bilden, und entsprechende Herstellungen, Zusammensetzungen und Verwendungen

2. Ansprüche: 1-5 (jeweils teilweise); 7, 8; 9-23 (jeweils teilweise)

Verbindungen der Formel I worin R1 und R2 zusammen keinen Ring bilden, und entsprechende Herstellungen, Zusammensetzungen und Verwendungen

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Die Recherche für die 2. Erfindung ergab in ihrer Anfangsphase eine sehr große Zahl neuheitsschädlicher Dokumente. Diese Zahl ist so groß, daß sich unmöglich feststellen lässt, für was in der Gesamtheit der Patentansprüche eventuell nach Recht Schutz begehrt werden könnte (Art. 6 PCT). Aus diesen Gründen erscheint eine sinnvolle Recherche über den gesamten Bereich der Patentansprüche unmöglich. Die Recherche wurde daher beschränkt auf die beanspruchte Struktur in Kombination mit der Verwendung in der Behandlung von Schmerz (vgl. vorliegende Beschreibung, Seite 1, Zeile 11).

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 02/08729

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 4898854	A	GR 861337 A1	23-09-1986
		HK 9994 A	09-02-1994
		HU 41041 A2	30-03-1987
		IE 58440 B1	22-09-1993
		JP 1935834 C	26-05-1995
		JP 6053752 B	20-07-1994
		JP 62026289 A	04-02-1987
		KR 9410292 B1	22-10-1994
		NO 862064 A ,B,	25-11-1986
		NZ 216282 A	29-09-1988
		PH 23848 A	23-11-1989
		PT 82626 A ,B	01-06-1986
		SG 136193 G	31-03-1994
		US 4906621 A	06-03-1990
		US 5057506 A	15-10-1991
		US 5217963 A	08-06-1993
		ZA 8603826 A	28-01-1987
		AT 60776 T	15-02-1991
		AU 610841 B2	30-05-1991
		AU 8145587 A	26-05-1988
		CA 1312608 A1	12-01-1993
		DD 273837 A5	29-11-1989
		DE 3768000 D1	14-03-1991
		DK 609487 A	22-05-1988
		EP 0275820 A2	27-07-1988
		ES 2031927 T3	01-01-1993
		FI 875097 A ,B,	22-05-1988
		GR 3001443 T3	25-09-1992
		HU 46331 A2	28-10-1988
		IE 60534 B1	27-07-1994
		JP 1135791 A	29-05-1989
		JP 1959482 C	10-08-1995
		JP 6086470 B	02-11-1994
		MX 9437 A	31-01-1994
		NO 874854 A ,B,	24-05-1988
		NZ 222607 A	26-10-1990
PH 25465 A	01-07-1991		
PT 86168 A ,B	01-12-1987		
ZA 8708699 A	23-05-1988		