



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20100033 T1

HR P20100033 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

C07D 309/10 (2006.01)

A61K 31/351 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.03.2010.

(21) Broj predmeta: P20100033T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 19.01.2010.

(66) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2006061956
Datum podnošenja međunarodne prijave: 02.05.2006.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 06763074.9
Datum podnošenja europske prijave patenta: 02.05.2006.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2006117359
Datum međunarodne objave: 09.11.2006.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1888552 A1
Datum objave europske prijave patenta: 20.02.2008.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1888552 B1
Datum objave europskog patenta: 23.12.2009.

(31) Broj prve prijave: 05009669
05018012

(32) Datum podnošenja prve prijave: 03.05.2005.
19.08.2005.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP
EP

(73) Nositelj patenta:

**Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216
Ingelheim am Rhein, DE**

(72) Izumitelji:

**Matthias Eckhardt, Kirschenweg 7, 88400 Biberach, DE
Frank Himmelsbach, Ahornweg 16, 88441 Mittlbiberach, DE
Sandra Sick, Erlenweg 3, 88454 Hochdorf, DE
Martin Schuehle, Sebastian Sailer Strasse 38, 88447 Oberhöfen, DE
Hans-Jürgen Martin, Boehringer Ingelheim Pharma GmbH CD-Patents,
Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE**

(74) Zastupnik:

CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.d., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

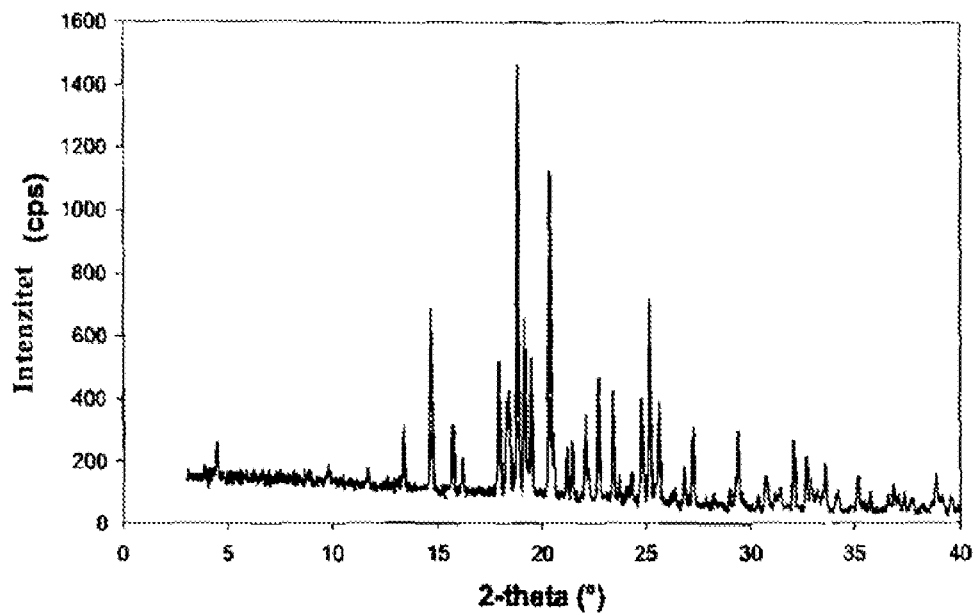
**KRISTALINIČNI OBLIK 1-KLORO-4-(β -D-GLUKOPIRANOZA-1-IL)-2-[4-((S)-
TETRAHIDROFURAN-3-ILOKSI)-BENZIL]-BENZEN, POSTUPAK NJEGOVE PRIPRAVE I
NJEGOVA UPORABA KOD IZRADE LIJEKOVA**

HR P20100033 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

- 5 1. Kristalinični oblik 1-kloro-4-(β-D-glukopiranoza-1-il)-2-[4-((S)-tetrahidrofuran-3-iloksi)-benzil]-benzen, **naznačen time**, da ima sliku difrakcije praška X-zrakama koja sadrži pikove na 18.84, 20.36 i 25.21 stupnjeva 2θ (±0.05 stupnjeva 2θ) pri čemu je navedena slika difrakcije praška X-zrakama načinjena uporabom CuK_{α1} zračenja.
- 10 2. Kristalinični oblik u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da slika difrakcije praška X-zrakama nadalje sadrži pikove na 14.69, 19.16 i 19.50 stupnjeva 2θ (±0.05 stupnjeva 2θ) pri čemu je navedena slika difrakcije praška X-zrakama načinjena uporabom CuK_{α1} zračenja.
3. 1-kloro-4-(β-D-glukopiranoza-1-il)-2-[4-((S)-tetrahidrofuran-3-iloksi)-benzil]-benzen, **naznačen time**, da je barem 50% navedene supstancije prisutno u obliku kristaliničnog oblika u skladu sa zahtjevom 1 ili 2.
- 15 4. Farmaceutski pripravak, **naznačen time**, da sadrži kristalinični oblik u skladu sa zahtjevom 1 ili 2.
5. Uporaba kristaliničnog oblika u skladu sa zahtjevom 1 ili 2, **naznačena time**, da se koristi za pripremu farmaceutskog pripravka koji je prikladan za liječenje ili prevenciju oboljenja ili stanja na koja se može utjecati inhibicijom natrij-ovisnog glukoza kotransportera SGLT.
- 20 6. Uporaba kristaliničnog oblika u skladu sa zahtjevom 1 ili 2, **naznačena time**, da se koristi za pripremu farmaceutskog pripravka koji je prikladan za liječenje ili prevenciju metaboličkih poremećaja, posebice metaboličkog poremećaja izabranog iz skupine koju čine dijabetes melitus tipa 1 i tipa 2, komplikacije dijabetesa, metaboličke acidoze ili ketoze, reaktivna hipoglikemija, hiperinzulinemija, metabolički poremećaj glukoze, inzulinska rezistencija, metabolički sindrom, dislipidemije različitih etiologija, ateroskleroza i povezani poremećaji, debljina, povišeni krvni tlak, kronično srčano zatajenje, edem i hiperurikemija.
- 25 7. Uporaba kristaliničnog oblika u skladu sa zahtjevom 1 ili 2, **naznačena time**, da se koristi za pripremu farmaceutskog pripravka za liječenje dijabetesa, posebno dijabetes melitusa tipa 1 i tipa 2 i/ili komplikacija dijabetesa.
8. Uporaba kristaliničnog oblika u skladu sa zahtjevom 1 ili 2, **naznačena time**, da se koristi za pripremu farmaceutskog pripravka za inhibiciju natrij-ovisnog glukoza kotransportera SGLT2.
- 30 9. Uporaba kristaliničnog oblika u skladu sa zahtjevom 1 ili 2, **naznačena time**, da se koristi za pripremu farmaceutskog pripravka za prevenciju degeneracije beta stanica gušterače i/ili za poboljšanje i/ili ponovno uspostavljanje funkcionalnosti beta stanica gušterače.
10. Uporaba kristaliničnog oblika u skladu sa zahtjevom 1 ili 2, **naznačena time**, da se koristi za pripremu farmaceutskog pripravka za prevenciju ili liječenje prekomjerne tjelesne težine, debljine, visceralne debljine i/ili abdominalne debljine.
- 35 11. Postupak za izradu kristaliničnog oblika u skladu sa zahtjevom 1 ili 2, **naznačen time**, da navedeni postupak sadrži slijedeće korake:
 - (a) otapanje 1-kloro-4-(β-D-glukopiranoza-1-il)-2-[4-((S)-tetrahidrofuran-3-iloksi)-benzil]-benzena u otapalu ili smjesi otapala tako da se formira zasićena ili gotovo zasićena otopina;
 - 40 (b) ostavljanje otopine da iz otopine precipitira kristalinični oblik u skladu sa zahtjevom 1 ili 2 i da se tako dobije suspenzija;
 - (c) izolacija precipitata iz suspenzije; te
 - (d) sušenje precipitata do uklanjanja svakog ostatka navedenog otapala ili smjese otapala.

Slika 1: Slika difrakcije kristaliničnog oblika praška X-zrakama



Slika 2: DSC i TG dijagram kristaliničnog oblika

