



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20241294 T1

HR P20241294 T1

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

(51) MKP:

C07D 401/12 (2006.01)

A61K 31/496 (2006.01)

A61P 25/04 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 06.12.2024.

(21) Broj predmeta: P20241294T

(22) Datum podnošenja: 12.09.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2019050771
Datum podnošenja međunarodne prijave: 12.09.2019.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 19778721.1
Datum podnošenja europske prijave patenta: 12.09.2019.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2020056105
Datum međunarodne objave: 19.03.2020.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3849970 A1
Datum objave europske prijave patenta: 21.07.2021.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3849970 B1
Datum objave europskog patenta: 03.07.2024.

(31) Broj prve prijave: 201862731014 P

(32) Datum podnošenja prve prijave:

13.09.2018.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelji patenta:

Celgene Corporation, Route 206 & Province Line Road, Princeton, NJ 08543, US

Lundbeck La Jolla Research Center, Inc., 251 Little Falls Drive, Wilmington, New Castle County, DE 19808, US

(72) Izumitelji:

Lianfeng Huang, 556 Morris Avenue, Summit, NJ 07901, US

Nancy Tsou, 556 Morris Avenue, Summit, NJ 07901, US

Nicole Suzanne White, 3672 Caminito Cielo Del Mar, San Diego, CA 92130, US

Jun Xu, Crystal Pharmatech Co., LTD., Suite 101, Bldg B4, Biobay, 218 Xinghu Street, Suzhou Industrial Park, 215123 Suzhou, CN

Qun Zhang, Crystal Pharmatech Co., LTD., Suite 101, Bldg B4, Biobay, 218 Xinghu Street, Suzhou Industrial Park, 215123 Suzhou, CN

(74) Zastupnik:

ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

KRISTALNI (R)-5-KARBAMOILPIRIDIN-3-IL-2-METIL-4-(3-(TRIFLUOROMETOKSI)BENZIL) PIPERAZIN-1-KARBOKSILAT, PRIPRAVCI I POSTUPCI NJEGOVE UPOTREBE

HR P20241294 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Kristalni oblik A (R)-5-karbamoilpiridin-3-il-2-metil-4-(3-(trifluorometoksi)benzil)piperazin-1-karboksilata koji ima uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu koji sadrži vrhove na 18,1, 20,1, i 22,3 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å.
2. Kristalni oblik A prema zahtjevu 1, naznačen time što uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu nadalje sadrži vrhove na 9,9, 19,9, i 24,7 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å; i/ili ima termogram diferencijalne pretražne kalorimetrije koji sadrži endotermu s maksimumom na 113 °C; i/ili ima termogram termogravimetrijske analize koji uključuje gubitak težine manji od 0,1% pri zagrijavanju od 30 °C do 150 °C.
3. Kristalni oblik B (R)-5-karbamoilpiridin-3-il-2-metil-4-(3-(trifluorometoksi)benzil)piperazin-1-karboksilata koji ima uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu koji sadrži vrhove na 16,2, 18,2, i 19,2 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å.
4. Kristalni oblik B prema zahtjevu 3, naznačen time što uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu nadalje sadrži vrhove na 15,1, 18,7, i 20,1 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å; i/ili ima termogram diferencijalne pretražne kalorimetrije koji sadrži endotermu s maksimumom na 95 °C; i/ili ima termogram termogravimetrijske analize koji uključuje gubitak težine manji od 1,0% pri zagrijavanju od 30 °C do 150 °C.
5. Kristalni oblik C (R)-5-karbamoilpiridin-3-il-2-metil-4-(3-(trifluorometoksi)benzil)piperazin-1-karboksilata koji ima uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu koji sadrži vrhove na 18,0, 20,0, i 21,0 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å.
6. Kristalni oblik C prema zahtjevu 5, naznačen time što uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu nadalje sadrži vrhove na 12,3, 16,8, i 25,5 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å; i/ili ima termogram diferencijalne pretražne kalorimetrije koji sadrži endotermu s maksimumom na 99 °C; i/ili ima termogram termogravimetrijske analize koji uključuje gubitak težine manji od 1,0% pri zagrijavanju od 30 °C do 150 °C.
7. Kristalni oblik D (R)-5-karbamoilpiridin-3-il-2-metil-4-(3-(trifluorometoksi)benzil)piperazin-1-karboksilata koji ima uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu koji sadrži vrhove na 13,4, 21,0, i 23,8 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å.
8. Kristalni oblik D prema zahtjevu 7, naznačen time što uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu nadalje sadrži vrhove na 18,3, 26,7, i 29,5 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å; i/ili ima termogram diferencijalne pretražne kalorimetrije koji sadrži endotermu s maksimumom na 101 °C; i/ili ima termogram termogravimetrijske analize koji uključuje gubitak težine manji od 1,0% pri zagrijavanju od 30 °C do 150 °C.
9. Kristalni oblik E (R)-5-karbamoilpiridin-3-il-2-metil-4-(3-(trifluorometoksi)benzil)piperazin-1-karboksilata koji ima uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu koji sadrži vrhove na 17,8, 21,3, i 22,8 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å.
10. Kristalni oblik E prema zahtjevu 9, naznačen time što uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu nadalje sadrži vrhove na 15,8, 18,4, i 21,9 stupnjeva $2\theta \pm 0,2$ stupnjeva 2θ korištenjem Cu K α zračenja na 1,54 Å; i/ili ima termogram diferencijalne pretražne kalorimetrije koji sadrži endotermu s maksimumom na 104 °C; i/ili ima termogram termogravimetrijske analize koji uključuje gubitak težine manji od 1,0% pri zagrijavanju od 30 °C do 150 °C.
11. Kristalni oblik prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, koji je uglavnom fizički čist, pri čemu kristal iz toga koji je uglavnom fizički čist sadrži manje od oko 50% jednog ili više drugih krutih oblika na težinskoj osnovi; i/ili koji je uglavnom kemijski čist, pri čemu kristalni oblik koji je uglavnom kemijski čist sadrži manje od oko 50% jednog ili više drugih kemijskih spojeva na težinskoj osnovi.
12. Farmaceutski pripravak, naznačen time što sadrži kristalni oblik prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva.
13. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11 ili farmaceutski pripravak prema zahtjevu 12 za upotrebu u postupku za
 - (a) liječenje boli; ili
 - (b) liječenje neuroloških poremećaja; ili
 - (c) liječenje tjeskobe; ili
 - (d) liječenje upalne bolesti crijeva; ili
 - (e) liječenje neuropatske boli; ili
 - (f) liječenje proliferacije i migracije stanica raka,
 pri čemu postupak uključuje davanje spoja ili farmaceutskog pripravka.