



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20090640 T1

HR P20090640 T1

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

(51) MKP:

C07D 223/16 (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)
A61P 25/30 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.01.2010.

(21) Broj predmeta: P20090640T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 02.12.2009.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2005046983
Datum podnošenja međunarodne prijave: 20.12.2005.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 05855526.9
Datum podnošenja europske prijave patenta: 20.12.2005.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2006069363
Datum međunarodne objave: 29.06.2006.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1838677 A2
Datum objave europske prijave patenta: 03.10.2007.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1838677 B1
Datum objave europskog patenta: 09.09.2009.

(31) Broj prve prijave: 638221 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 21.12.2004.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Arena Pharmaceuticals, Inc., 6166 Nancy Ridge Drive, San Diego, CA, US
Rajesh Kumar Agarwal, 13237 Jacarte Court, 92130 San Diego, CA, US
William L. Betts III, 4518 Patria Drive, 92115 San Diego, CA, US
James A. Henshilwood, 2501 Sombrosa Place, 92009 Carlsbad, CA, US
Yuan-Hon Kiang, 3871 Rodene Street, 91320 Newbury Park, CA, US
Noah Post, 3520 Lebon Drive, Apt. 5315, 92122 San Diego, CA, US
CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.d., 10000 Zagreb, HR

(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma:

**KRISTALINIČNI OBLICI (R)-8-KLORO-1-METIL-2,3,4,5-TETRAHIDRO-1H-3-BENZAZEPIN
HIDROKLORIDA**

HR P20090640 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

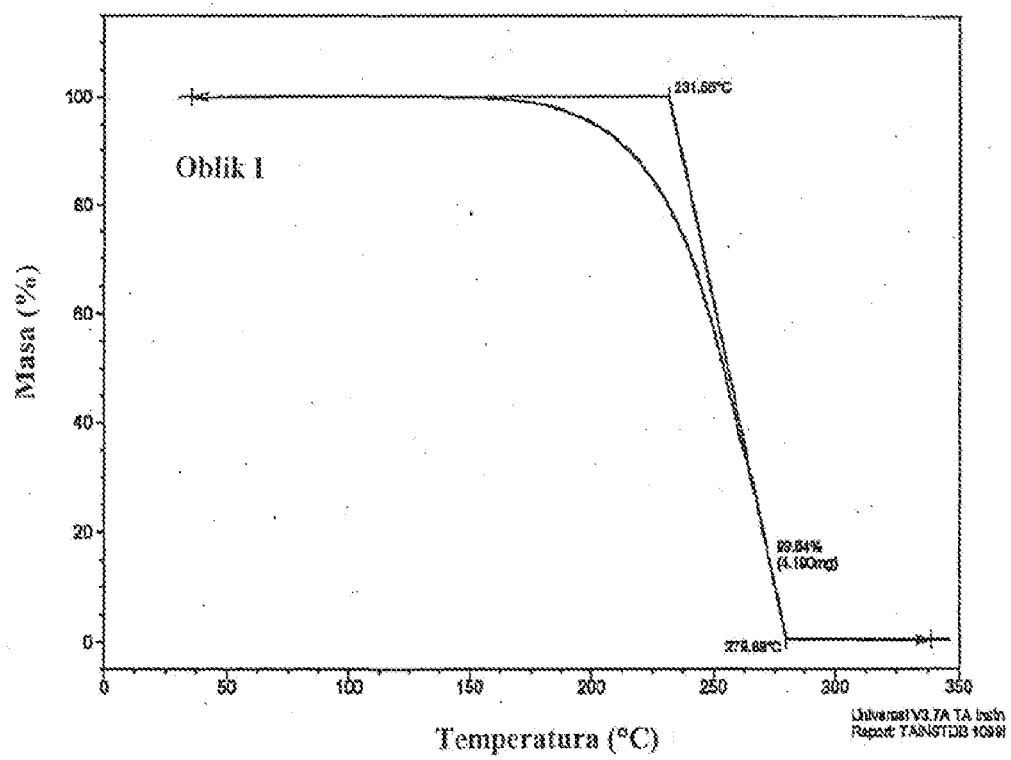
- 5 1. Spoj, **naznačen time**, da je (R)-8-kloro-1-metil-2,3,4,5-tetrahidro-1H-3-benzazepin hidroklorid hemihidrat.
2. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima uzorak difrakcije praha X-zrakama koji sadrži pikove, u značenju 2θ , na oko 13.7° i oko 14.9° .
3. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima uzorak difrakcije praha X-zrakama koji sadrži pikove, u značenju 2θ , na oko 13.7° , oko 14.9° , oko 15.4° , oko 15.8° , oko 16.7° , oko 20.1° i oko 21.4° .
- 10 4. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima uzorak difrakcije praha X-zrakama sadržajno isti kao prikazan na Slici 11.
5. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima zapis diferencijalne pretražne kalorimetrije koji sadrži endotermu između 90°C i 110°C .
6. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima zapis diferencijalne pretražne kalorimetrije koji sadrži endotermu između 90°C i 110°C i endotermu na oko 200°C .
- 15 7. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima zapis diferencijalne pretražne kalorimetrije sadržajno isti kao prikazan na Slici 10.
8. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima profil dinamičke sorpcije para sadržajno isti kao prikazan na Slici 12.
- 20 9. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima profil termogravimetrijske analize koji pokazuje gubitak mase oko 3.7% ispod oko 150°C .
10. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da ima profil termogravimetrijske analize sadržajno isti kao prikazan na Slici 9.
11. Hemihidrat u skladu sa zahtjevom 1, **naznačen time**, da navedeni spoj dobiva manje od oko 1.0% mase nakon podvrgavanja ciklusu dinamičke sorpcije para od 10% RH do 90% RH.
- 25 12. Pripravak, **naznačen time**, da sadrži hemihidrat u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11.
13. Pripravak u skladu sa zahtjevom 12, **naznačen time**, da navedeni hemihidrat čini najmanje oko 50% mase navedenog pripravka.
14. Pripravak u skladu sa zahtjevom 12, **naznačen time**, da navedeni hemihidrat čini najmanje oko 90% mase navedenog pripravka.
- 30 15. Pripravak u skladu sa zahtjevom 12, **naznačen time**, da navedeni hemihidrat čini najmanje oko 99% mase navedenog pripravka.
16. Pripravak, **naznačen time**, da sadrži hemihidrat u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11 i farmaceutski prihvatljivu podlogu.
- 35 17. Spoj u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačen time**, da se koristi u postupku liječenja ljudskog ili životinjskog tijela terapijom.
18. Spoj u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačen time**, da se koristi u postupku liječenja 5HT_{2C}-posredovanih poremećaja ljudskog ili životinjskog tijela terapijom.
19. Spoj u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačen time**, da se koristi u postupku liječenja poremećaja središnjeg živčanog sustava; oštećenja središnjeg živčanog sustava; kardiovaskularnog poremećaja; gastrointestinalnog poremećaja; dijabetesa insipidusa ili apneje spavanja.
- 40 20. Spoj u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačen time**, da se koristi u postupku liječenja depresije, atipične depresije, bipolarnog poremećaja, anksioznosti, opsesivno-kompulsivnog poremećaja, socijalne fobije ili stanja panike, poremećaja spavanja, seksualne disfunkcije, psihoza, šizofrenije, migrene ili stanja povezanih s glavoboljom ili ostalom boli, povećanog intakranijalnog tlaka, epilepsije, poremećaja osobnosti, poremećaja ponašanja povezanih sa dobi, poremećaja ponašanja povezanih sa demencijom, organskih mentalnih poremećaja, mentalnih poremećaja u djetinjstvu, agresivnosti, poremećaja pamćenja povezanih s dobi, sindroma kroničnog umora, odvikavanja od droga ili alkohola, debljine, bulimije, anoreksije nervoze ili predmenstrualne napetosti.
- 45 21. Spoj u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačen time**, da se koristi u postupku liječenja debljine.
22. Spoj u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačen time**, da se koristi u postupku smanjivanja uzimanja hrane.
- 50 23. Spoj u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačen time**, da se koristi u postupku izazivanja sitosti.
24. Spoj u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačen time**, da se koristi u postupku kontroliranja dobivanja na težini.
25. Uporaba spoja u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačena time**, da se koristi za izradu lijeka za liječenje poremećaja središnjeg živčanog sustava; oštećenja središnjeg živčanog sustava; kardiovaskularnog poremećaja; gastrointestinalnog poremećaja; dijabetesa insipidusa ili apneje spavanja.
- 55 26. Uporaba spoja u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačena time**, da se koristi za izradu lijeka za liječenje depresije, atipične depresije, bipolarnog poremećaja, anksioznosti, opsesivno-kompulsivnog poremećaja, socijalne fobije ili stanja panike, poremećaja spavanja, seksualne disfunkcije, psihoza, šizofrenije, migrene ili stanja povezanih sa glavoboljom ili ostalom boli, povećanog intakranijalnog tlaka, epilepsije, poremećaja osobnosti, poremećaja ponašanja povezanih sa dobi, poremećaja ponašanja povezanih sa demencijom, organskog mentalnog poremećaja, mentalnog poremećaja u djetinjstvu, agresivnosti, poremećaja pamćenja povezanih s dobi, sindroma
- 60

kroničnog umora, odvikavanja od droga ili alkohola, debljine, bulimije, anoreksije nervoze ili predmenstrualne napetosti.

27. Uporaba spoja u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačena time**, da se koristi za izradu lijeka za liječenje debljine.
- 5 28. Uporaba spoja u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačena time**, da se koristi za izradu lijeka za smanjivanje uzimanja hrane.
29. Uporaba spoja u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačena time**, da se koristi za izradu lijeka za izazivanje sitosti.
- 10 30. Uporaba spoja u skladu s bilo kojim zahtjevom 1 do 11, **naznačena time**, da se koristi za izradu lijeka za kontrolu dobivanja na težini.

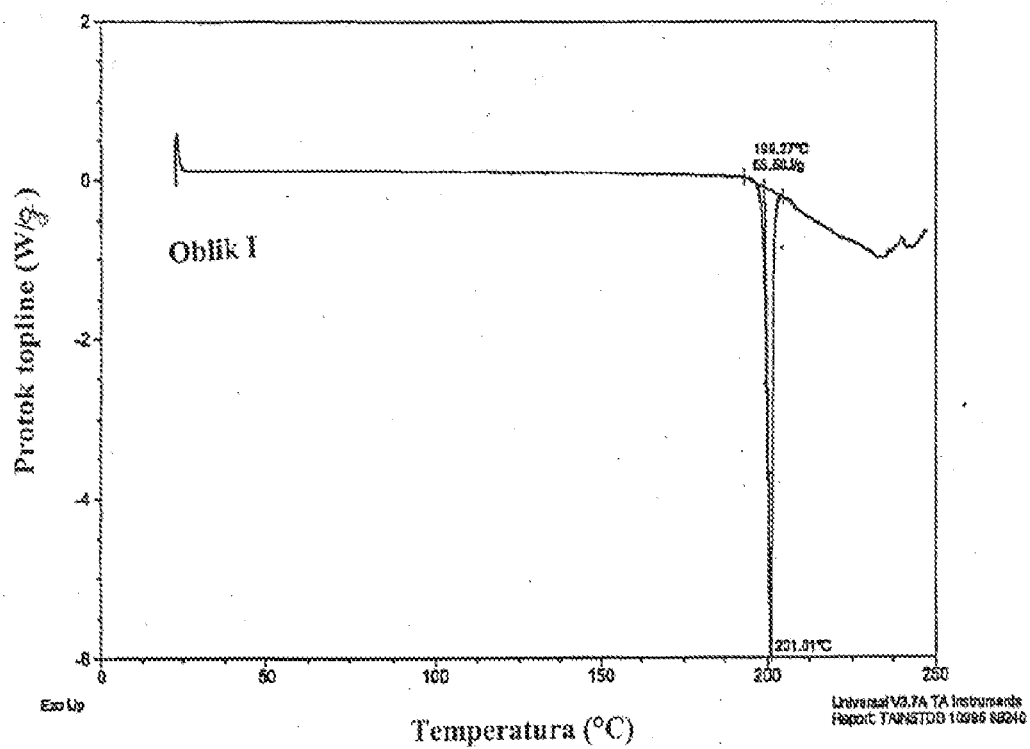
SLIKA 1

TGA oblik I



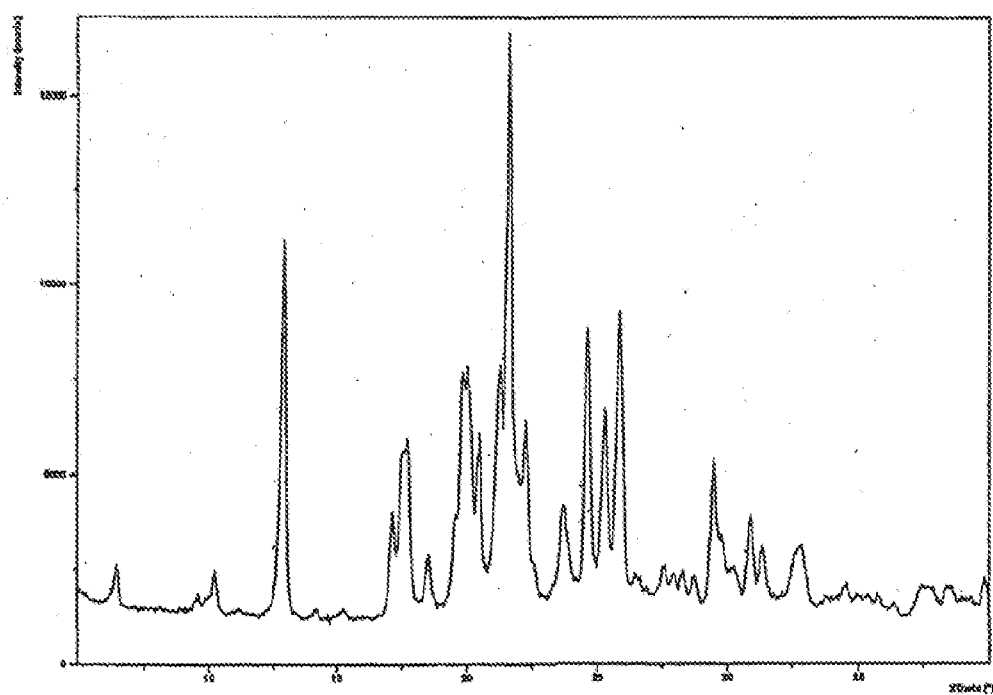
SLIKA 2

DSC oblik I



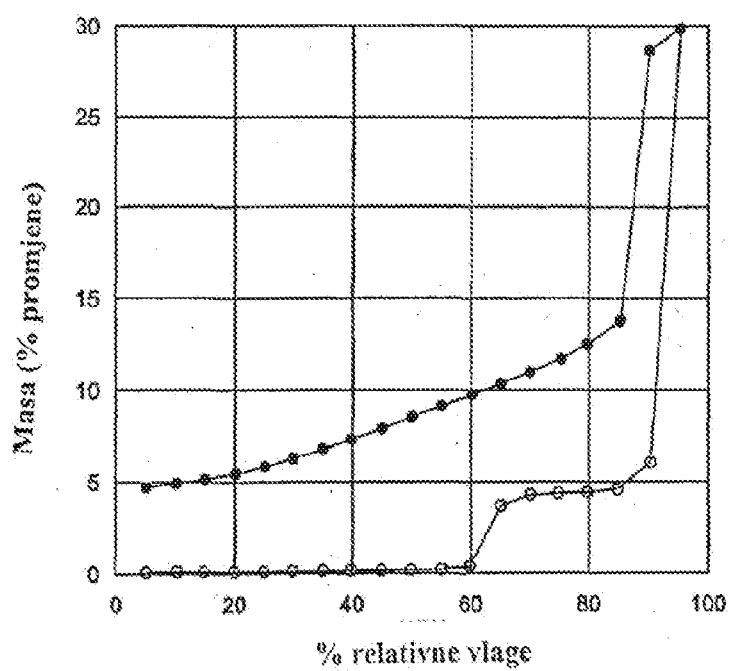
SLIKA 3

XRPD oblik I



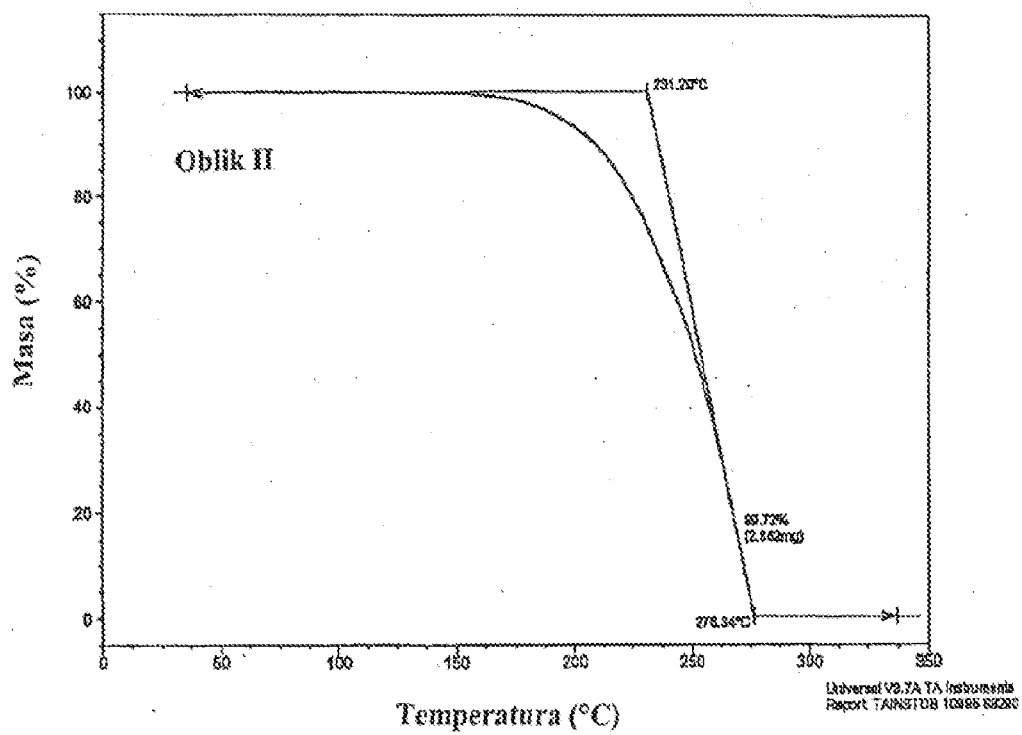
SLIKA 4

DVS oblik I



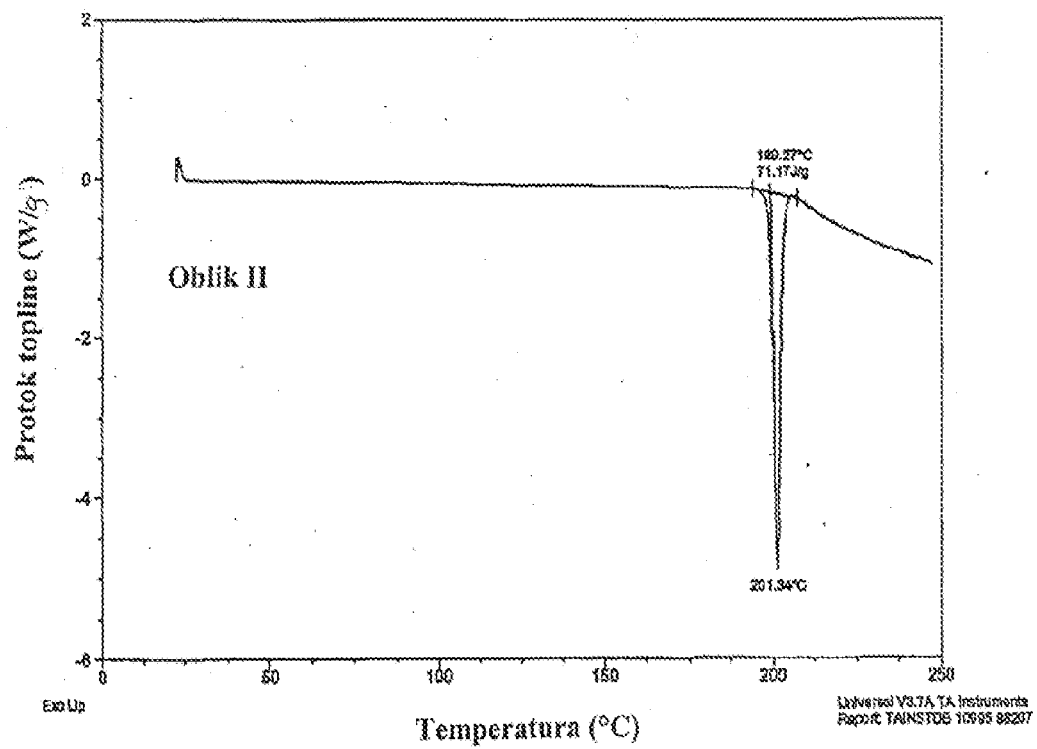
SLIKA 5

TGA oblik II



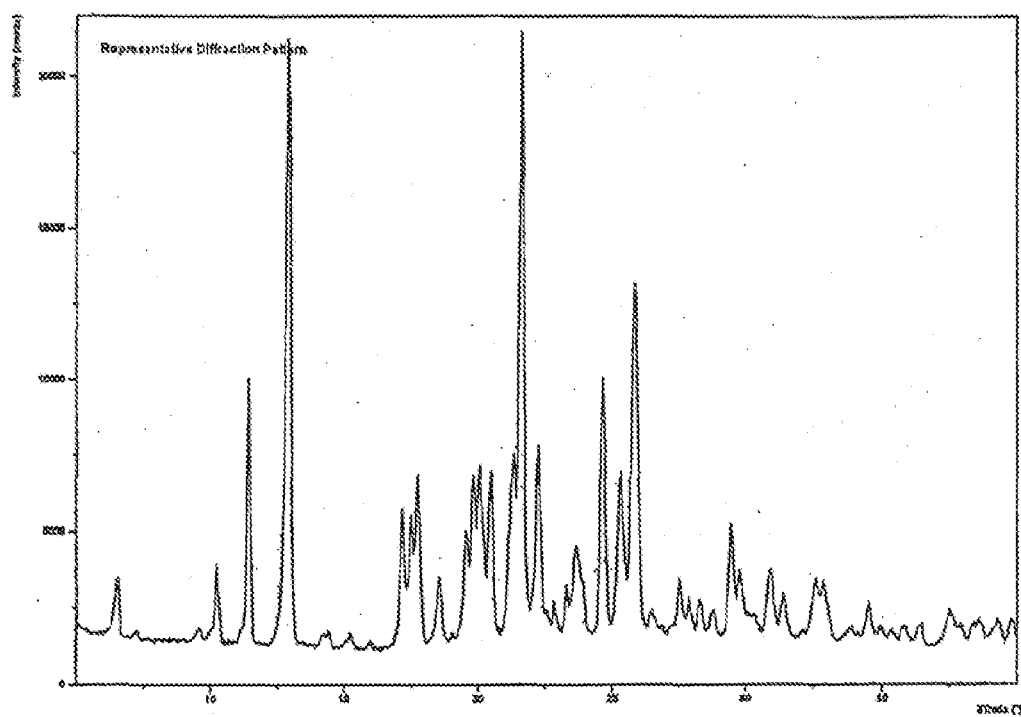
SLIKA 6

DSC oblik II



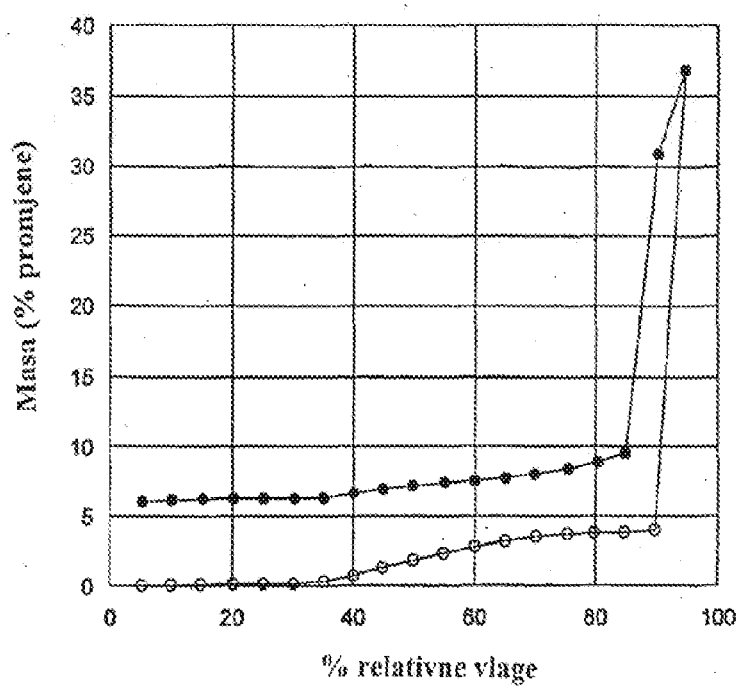
SLIKA 7

XRPD oblik II

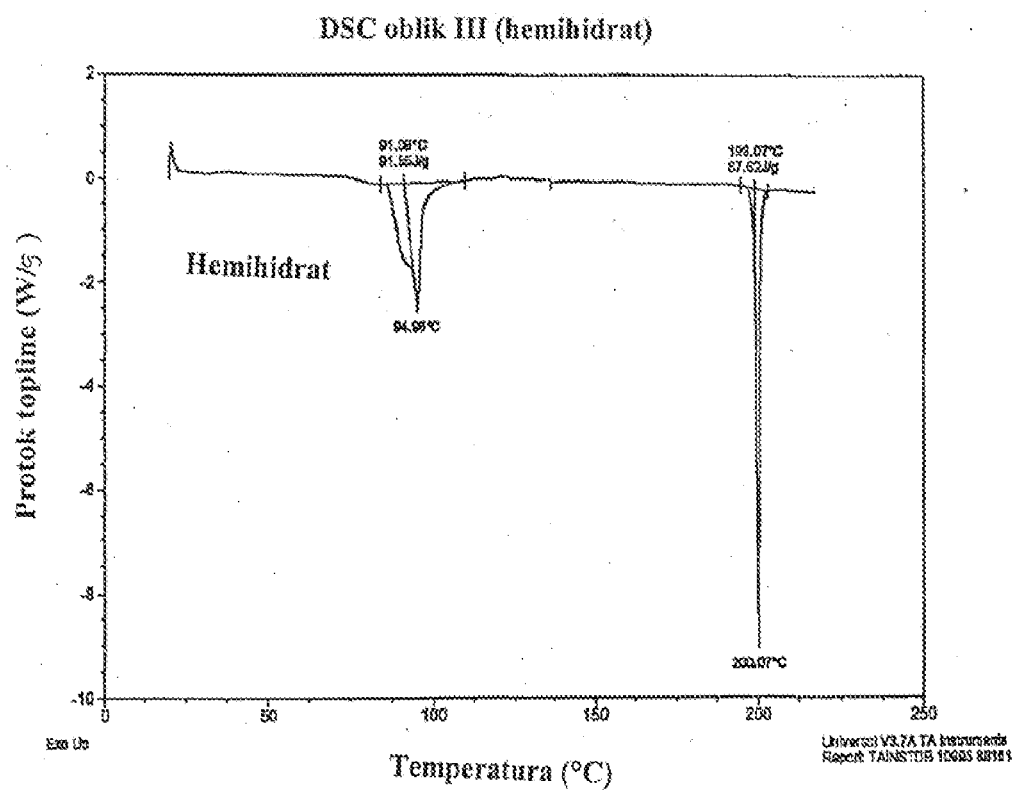


SLIKA 8

DVS oblik II

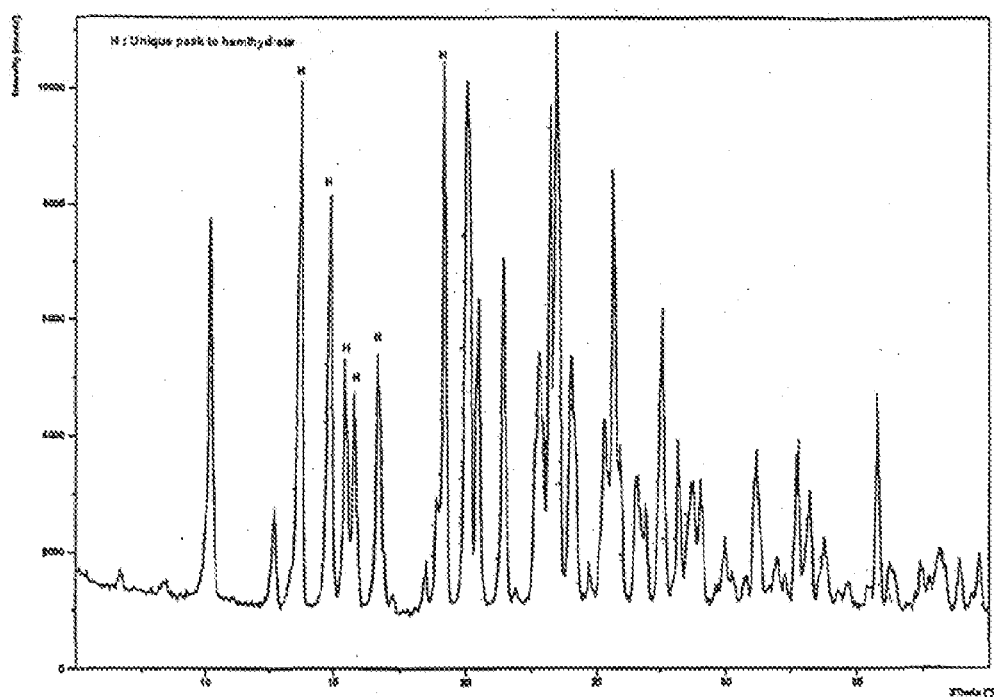


SLIKA 10



SLIKA 11

XRPD oblik III (hemihidrat)



SLIKA 12

DVS oblik III (hemihidrat)

