



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:



HR P20110412 T1

HR P20110412 T1

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

(51) MKP:

**C07D 211/20** (2006.01)  
**A61K 31/451** (2006.01)  
**A61P 25/04** (2006.01)  
**A61P 25/24** (2006.01)  
**A61P 25/28** (2006.01)  
**A61P 25/32** (2006.01)  
**A61P 25/34** (2006.01)  
**A61P 25/36** (2006.01)  
**A61P 25/22** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.06.2011.

(21) Broj predmeta: P20110412T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 03.06.2011.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/DK2007050076  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 15.06.2007.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 07764496.1  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 15.06.2007.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2007144006  
Datum međunarodne objave: 21.12.2007.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2044020 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 08.04.2009.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2044020 B1  
Datum objave europskog patenta: 04.05.2011.

(31) Broj prve prijave: 805009 P  
200600816  
200700423

(32) Datum podnošenja prve prijave: 16.06.2006.  
16.06.2006.  
20.03.2007.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US  
DK  
DK

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelj:

**H. Lundbeck A/S, Ottiliavej 9, 2500 Valby-Copenhagen, DK**  
**Benny Bang-Andersen, Lillegrund 33, 2300 Copenhagen S, DK**  
**André Faldt, Vejlebrovej 14H, 2635 Ishøj, DK**  
**Tine Bryan Stensbøl, Evavej 21, 3500 Värölse, DK**  
**Silke Miller, 108 Arcadian Trl, Monroe, NY 10950, US**  
**Heidi Lopez de Diego, Hälderne 5, 2850 Nærum, DK**  
odvjetnik Damir Mijatović, 10000 Zagreb, HR

(74) Zastupnik:

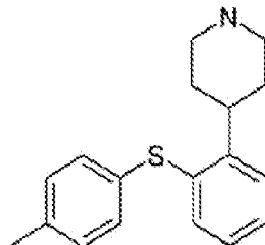
(54) Naziv izuma:

**KRISTALNI OBLICI 4-[2-4-(4-METILFENILSULFANIL)FENIL]PIPERIDINA SA KOMBINIRANOM  
INHIBICIJOM REAPSORPCIJE SEROTONINA I NOREPINEFRINA ZA LIJEČENJE  
NEUROPATSKIH BOLOVA**

HR P20110412 T1

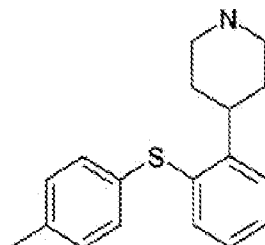
## PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj koji je 4-[2-(4-metilfenil-sulfanil)fenil]piperidin,



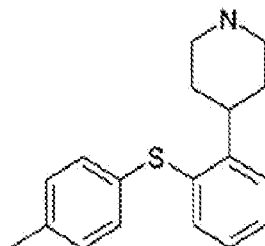
**naznačen time** što je HBr adicijska sol u kristalnom obliku.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** što pikovima na XRPD približno za 6,08, 14,81, 19,26 i 25,38°2θ.  
 3. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** što sa XRPD koji je prikazan na Slici 1.  
 4. Spoj koji je 4-[2-(4-metilfenil-sulfanil)fenil]piperidin,



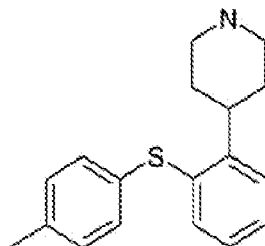
**naznačen time** što je adicijska sol DL-mliječne kiseline u kristalnom obliku.

5. Spoj koji je 4-[2-(4-metilfenil-sulfanil)fenil]piperidin,



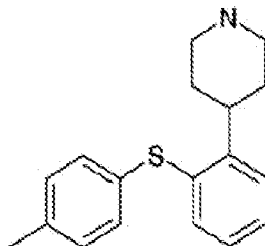
**naznačen time** što je adicijska sol glutarne kiseline (1:1).

6. Spoj koji je 4-[2-(4-metilfenil-sulfanil)fenil]piperidin



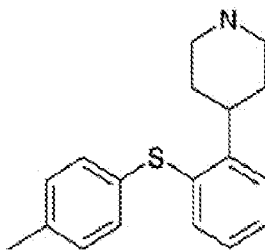
**naznačen time** što je adicijska sol malonske kiseline (1:1) u kristalnom obliku.

7. Spoj koji je 4-[2-(4-metilfenil-sulfanil)fenil]piperidin



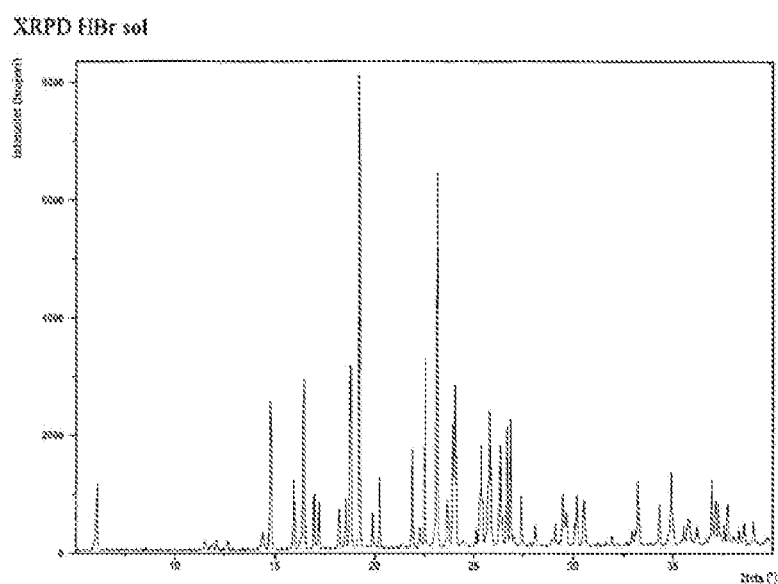
**naznačen time** što je adicijska sol L-asparaginske kiseline (1:1) ili hidrat adicijske soli L-asparaginske kiseline (1:1) u kristalnom obliku.

8. Spoj koji je 4-[2-(4-metilfenil-sulfanil)fenil]piperidin

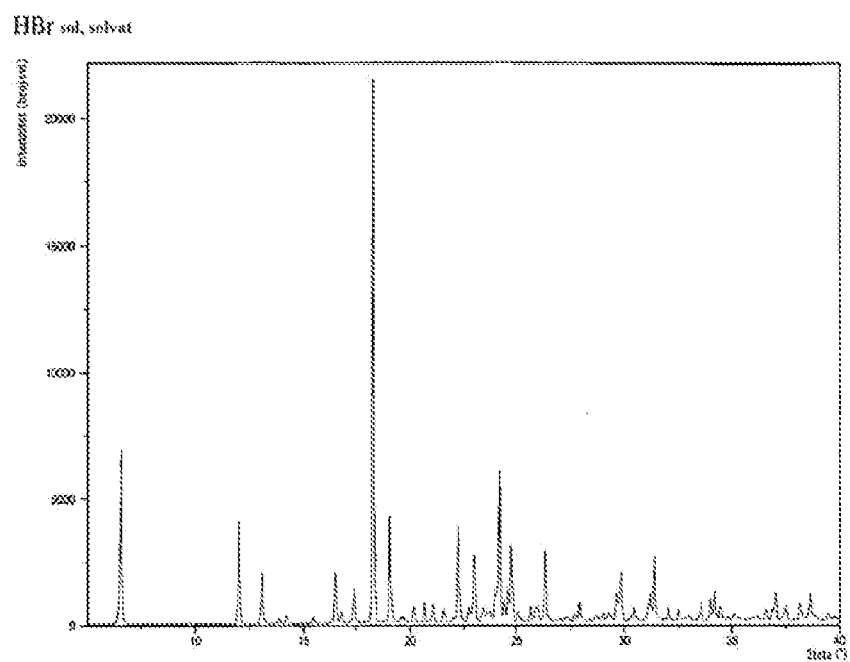


**naznačen time** što je adicijska sol glutaminske kiseline (1:1) ili monohidrat adicijske soli glutaminske kiseline u kristalnom obliku.

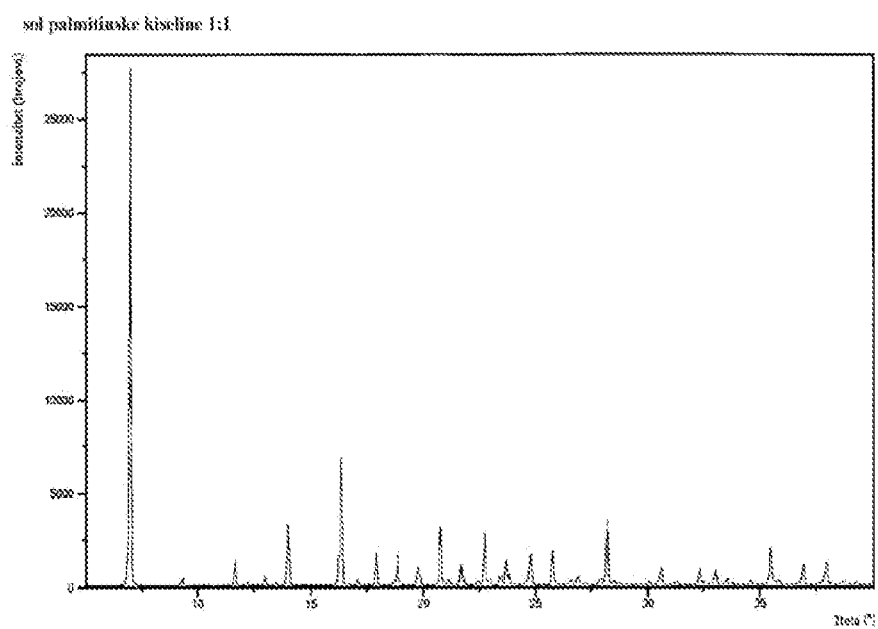
9. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-8, **naznačen time** što se koristi u liječenju.
10. Farmaceutska kompozicija koja sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-8, **naznačena time** što je zajedno sa farmaceutski prihvatljivim ekscipijensolm.
11. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-8, **naznačen time** što se koristi u liječenju bolesti izabrane između kroničnih bolova, depresije kod parcijalno reagirajućih pacijenata, liječenju rezistentne depresije, Alzenhajmerove bolesti, kognitivnih poremećaja, ADHD, melanholije, PTSD, valunga, apneje pri spavanju, ovisnosti od alkohola, nikotina ili ugljikohidrata, zlouporabe narkotika, zlouporabe alkohola ili lijekova, emezisa, poremećaja u ishrani, IBS, afektivnih poremećaja, depresije, sindroma „velike depresije“, postporođajne depresije, depresije povezane sa bipolarnim poremećajem, psihoze ili Parkinsonove bolesti, anksioznosti, općeg anksioznog poremećaja, solcijalnog anksioznog poremećaja, opsesivno-kompulzivnog poremećaja, napada panike, fobije, solcijalne fobije, agorafobije ili urinarne stres inkontinencije.
12. Spoj prema zahtjevu 11, **naznačen time** što se koristi u liječenju kroničnih bolova.
13. Spoj prema zahtjevu 12, **naznačen time** što se koristi u liječenju sindroma fantomskih bolova, neuropatskih bolova, dijabetičarske neuropatije, post-herpesne neuralgije (PHN), sindroma karpalnog tunela (CTS), HIV neuropatije, sindroma kompleksnih regionalnih bolova (CPRS), trigeniminalne neuralgije / trigeminusne neuralgije / bolnih tikova, kirurških intervencija (npr. postoperativna analgezija), dijabetičarske vaskulopatije, kapilarne rezistencije ili dijabetičarskih simptoma u vezi sa insulitisolm, bolova u vezi sa anginom, bolova u vezi sa menstruacijom, bolova u vezi sa tumorom, zubobolje, glavobolje, migrene, glavobolje tenzionog tipa, trigeminalne neuralgije, sindroma temporomandibularnog zgloba, bolova u kostima i zglobovima (osteoartritis), reumatoidnog artritisa, reumatoidnog artritisa i edema uzrokovanih traumom u vezi sa žiganjem, iščašenjima i frakturama kostiju zbog osteoartritisa, osteoporoze, metastaza u kostima ili iz nepoznatih razloga, gihta, fibrozitisa, miofascijalnih bolova, torakalnog sindroma, bolova u gornjem dijelu leđa ili bolova u donjem dijelu leđa (pri čemu su bolovi u leđima rezultat sistematske, regionalne ili primarne bolesti kičme (radikulopatija)), bolova u karlici, bolova u grudima izazvanog srčanim poremećajima, bolova u grudima koji nije izazvan srčanim poremećajima, bolova u vezi sa povredama kičmene moždine (SCI), središnjih bolova poslije moždanog udara, tumorske neuropatije, AIDS-a, bolova zbog srpastih stanica ili gerijatrijskih bolova.
14. Spoj prema zahtjevu 13, **naznačen time** što se koristi u liječenju neuropatskih bolova.
15. Spoj prema zahtjevu 14, **naznačen time** što čemu su spomenuti neuropatski bolovi izabrani između hiperpatije, hiperpalgezije, neuropatije, dijabetičarske neuropatije, neuritisa, neuralgije, hiperestezijske, kauzalgije i alodinije.



Slika 1

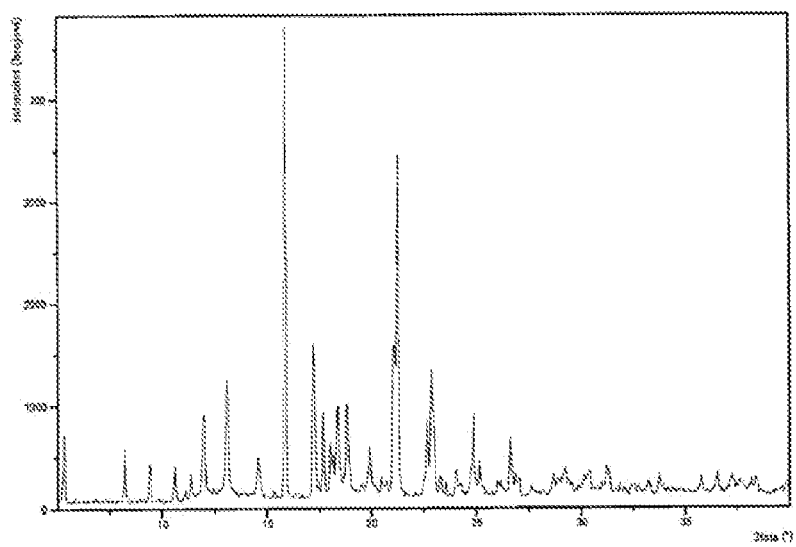


Slika 2



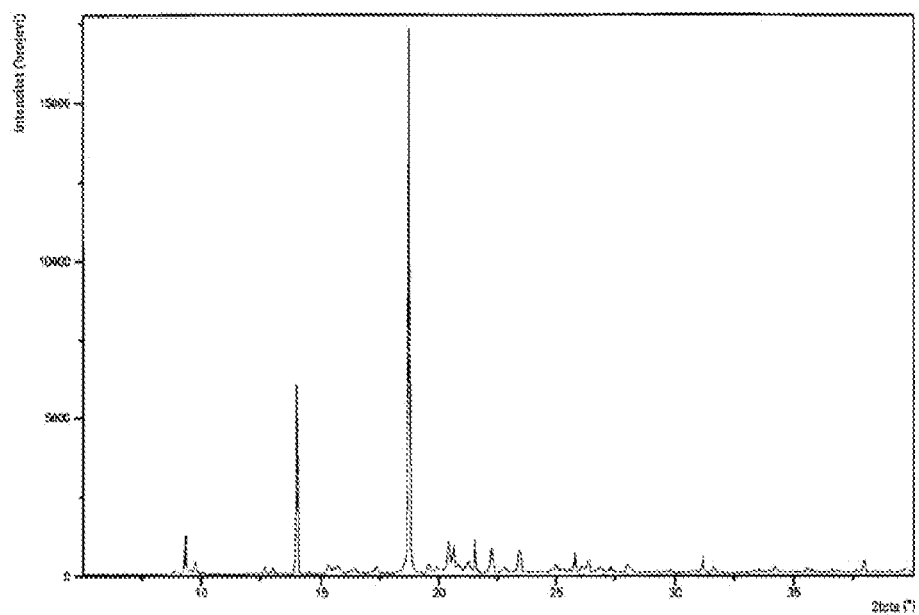
Slika 3

sol DL-mliječne kiseline 1:1



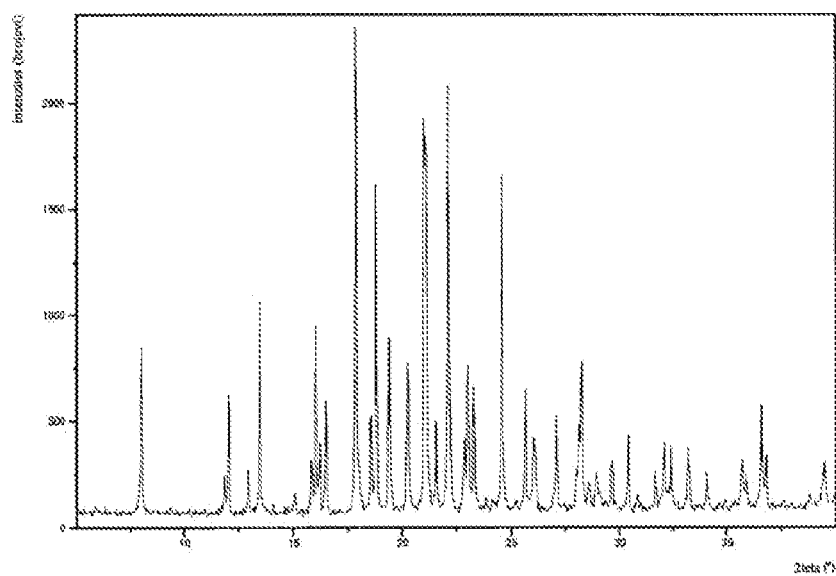
Slika 4

sol adipinske kisline 1:1(smjesa  $\alpha$  i  $\beta$  oblika)



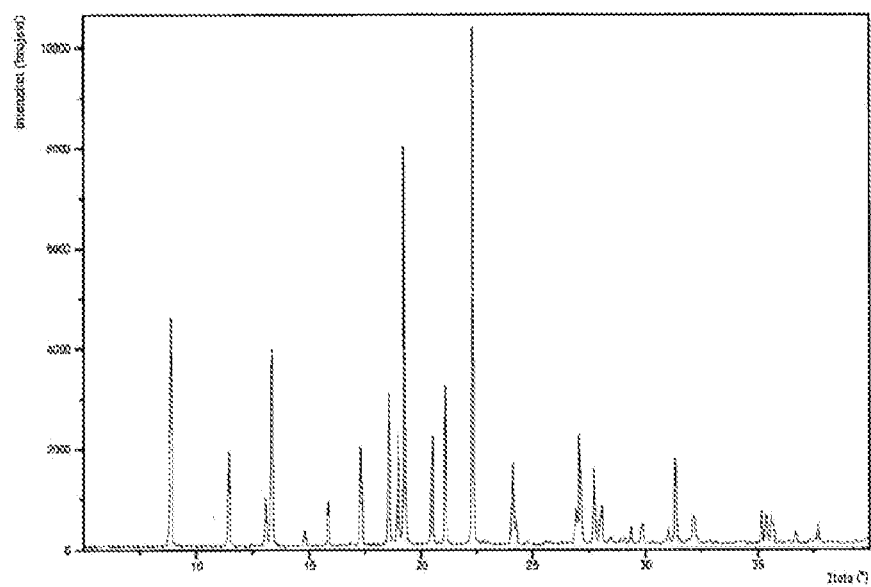
Slika 5

sol adipinske kisline 2:1



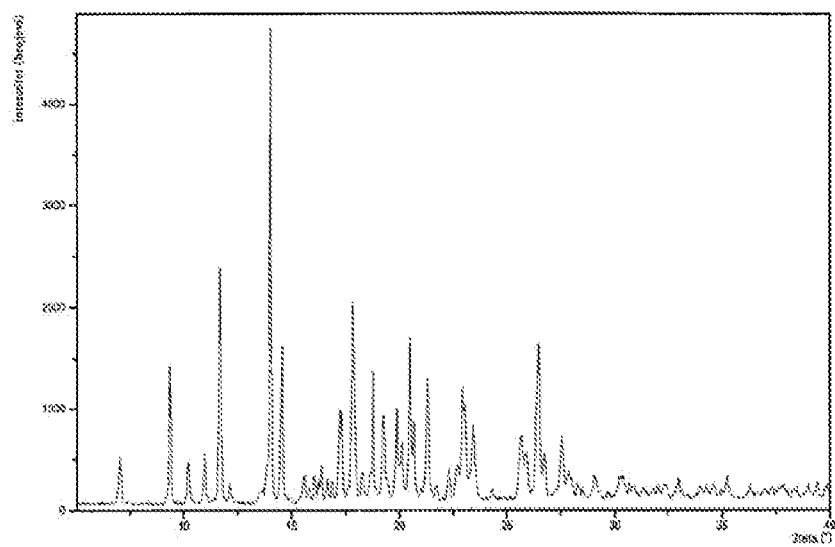
Slika 6

sol fumaric kiseline 1:1



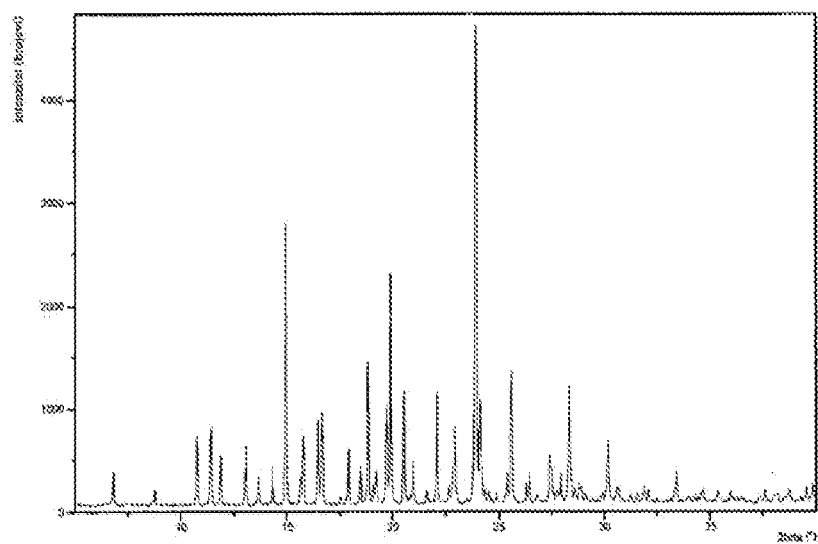
Slika 7

sol glutaric kiseline 1:1



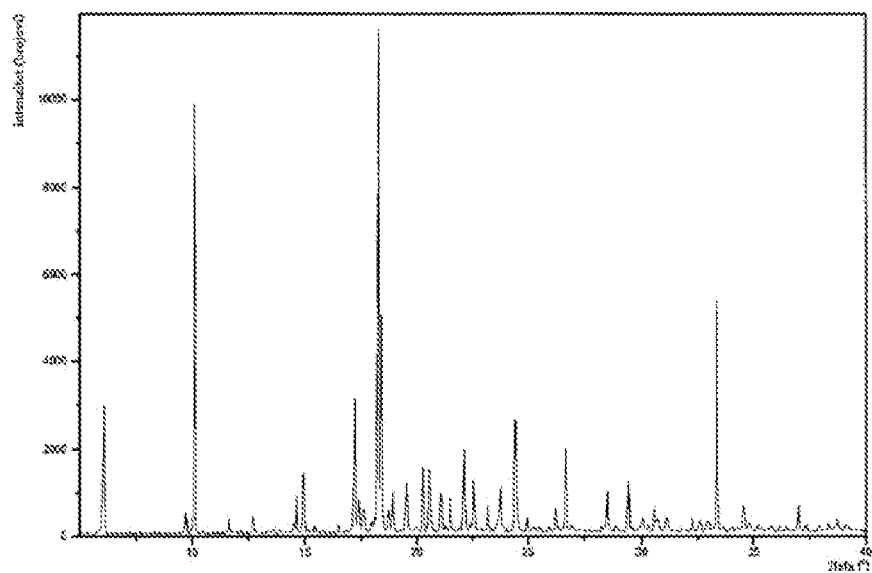
Slika 8

sol malonske kiseline 1:1,  $\alpha$  oblik



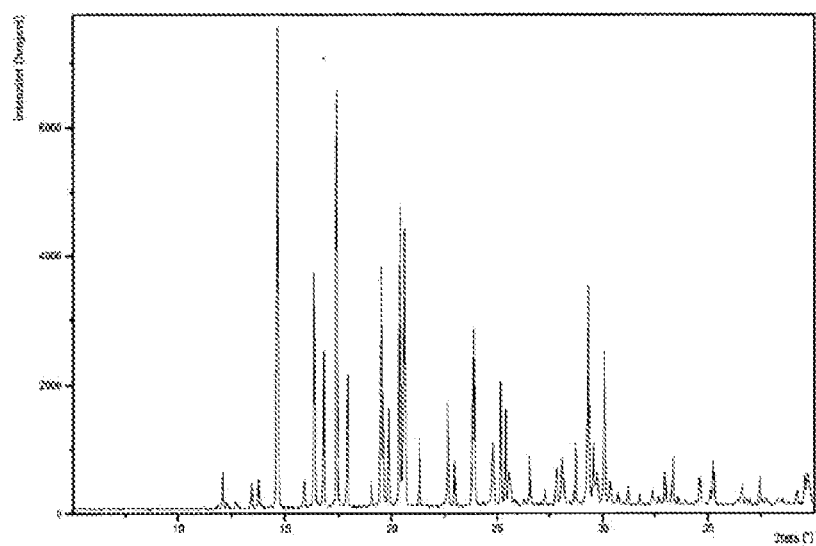
Slika 9

sol malonske kiseline 1:1,  $\beta$  oblik



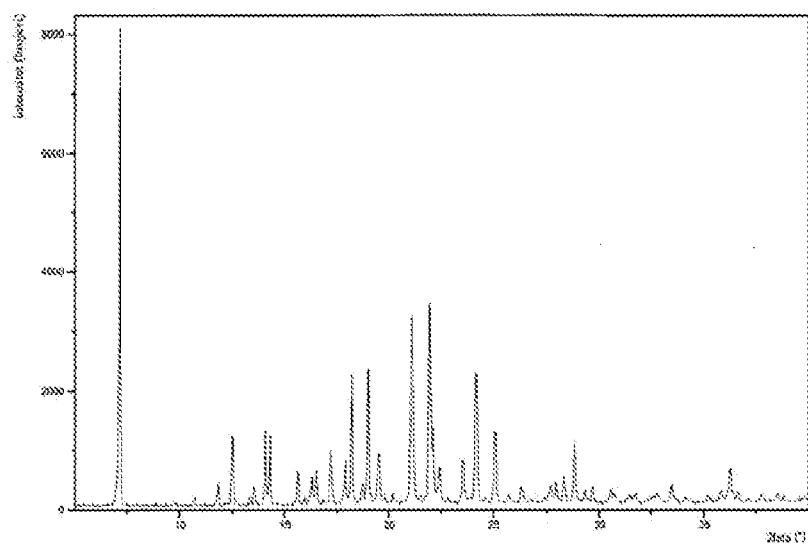
Slika 10

sol oksalne kiselina 1:1



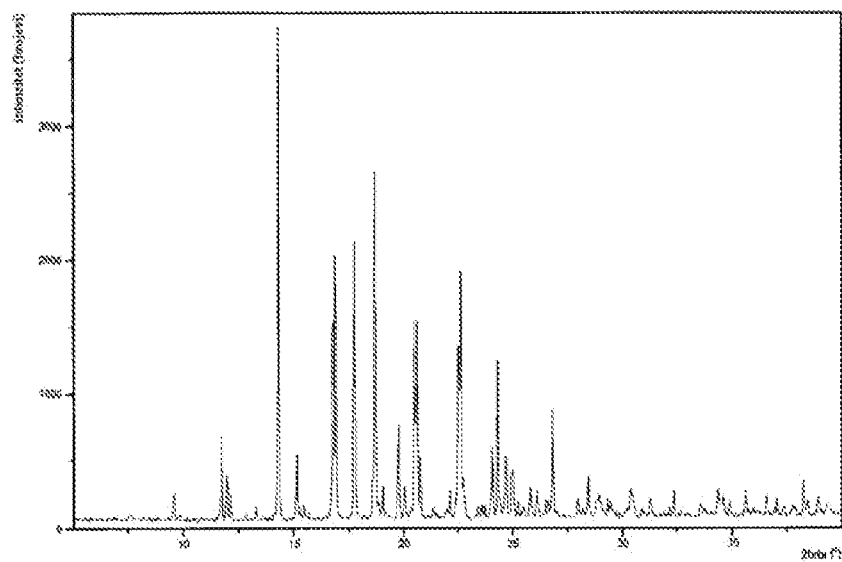
Slika 11

sol sebakoinse kiseline 2:1



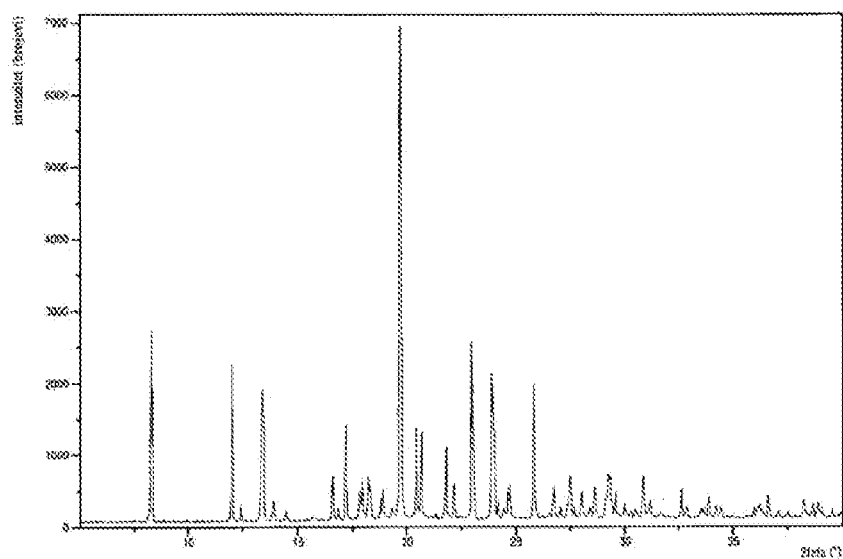
Slika 12

sol čilbarne kiseline 2:1



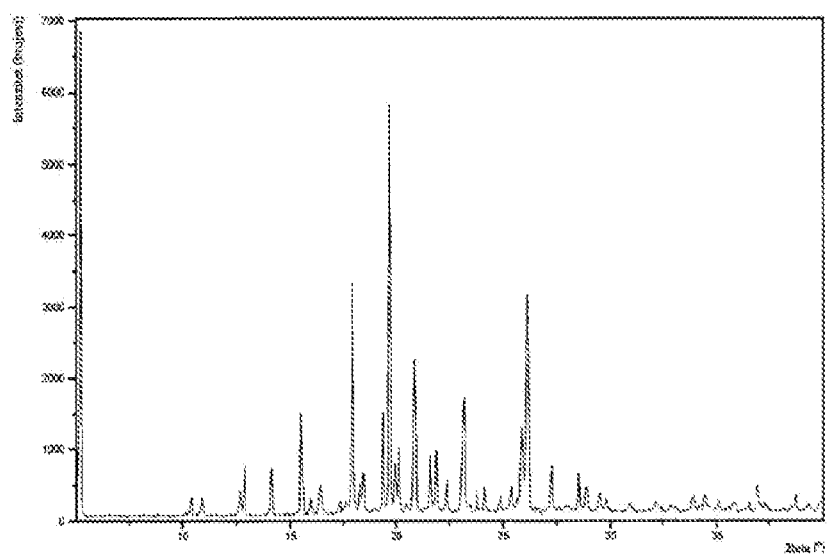
Slika 13

sol L-jabučne kiseline 1:1,  $\alpha$  oblik



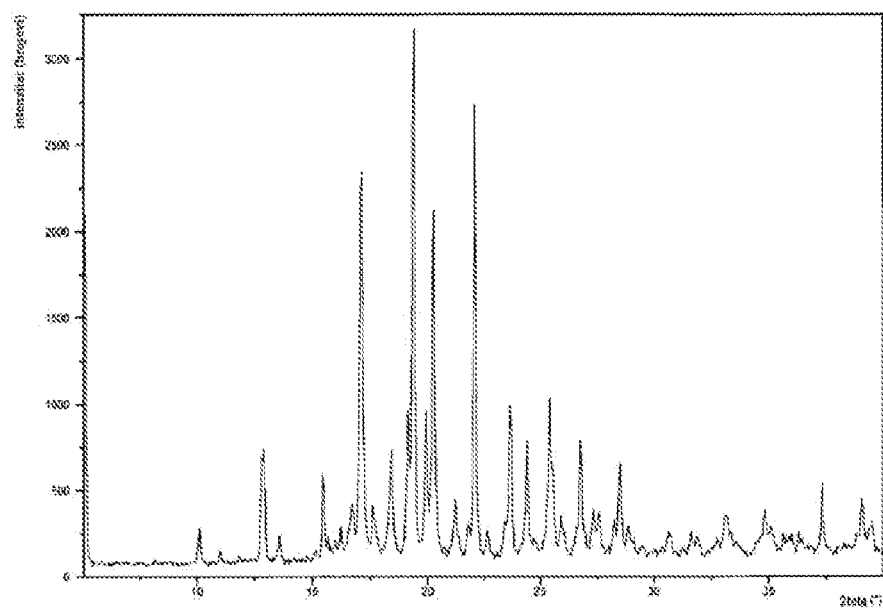
Slika 14

sol L-jabučne kiseline 1:1,  $\beta$  oblik



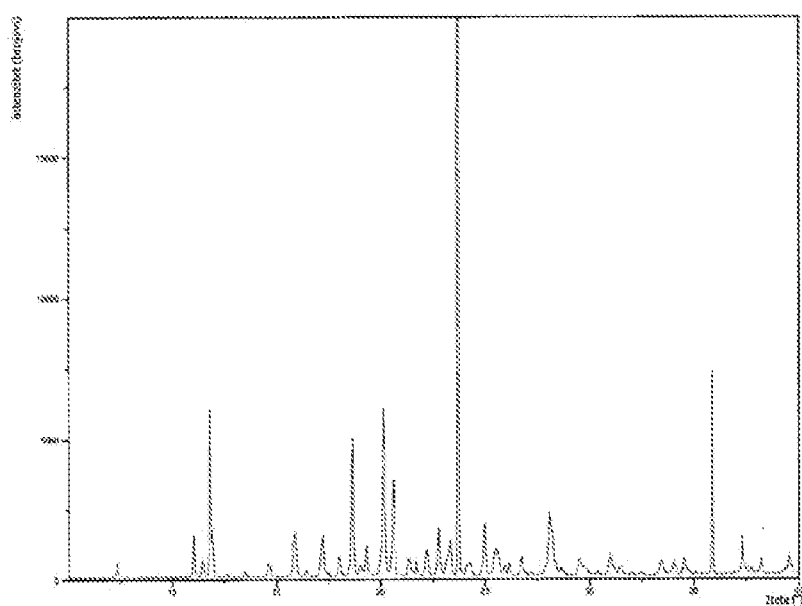
Slika 15

sol D-vinske kiseline 1:1



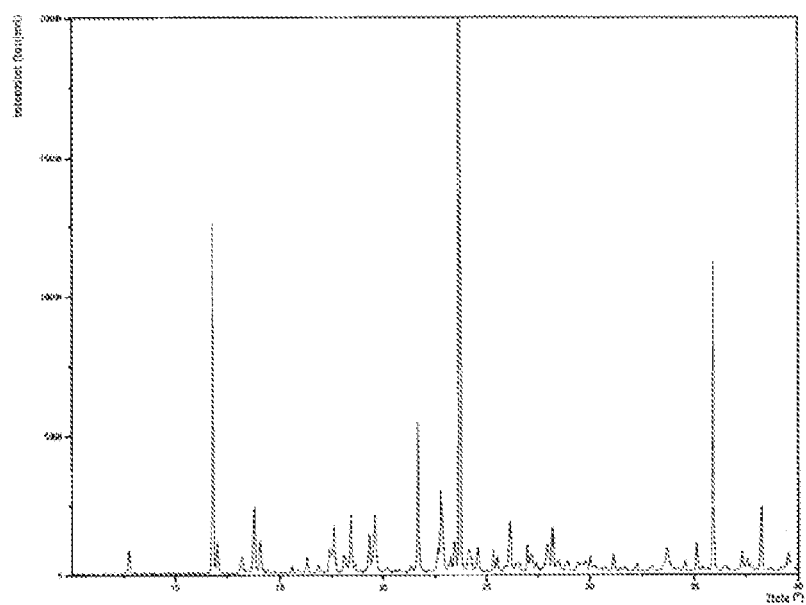
Slika 16

sol L-asparaginske kiseline 1:1 + L-asparaginska kiselina



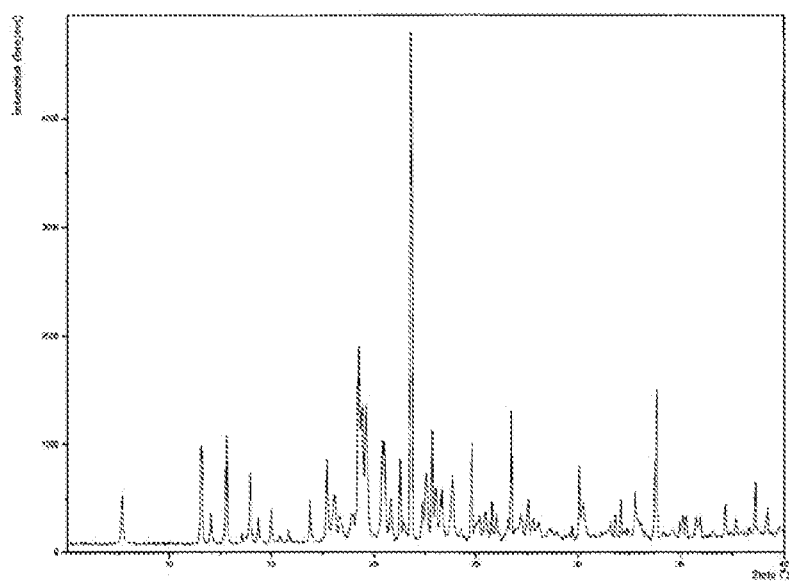
Slika 17

hidrat soli L-asparaginske kiseline 1:1 + L-asparaginska kiselina



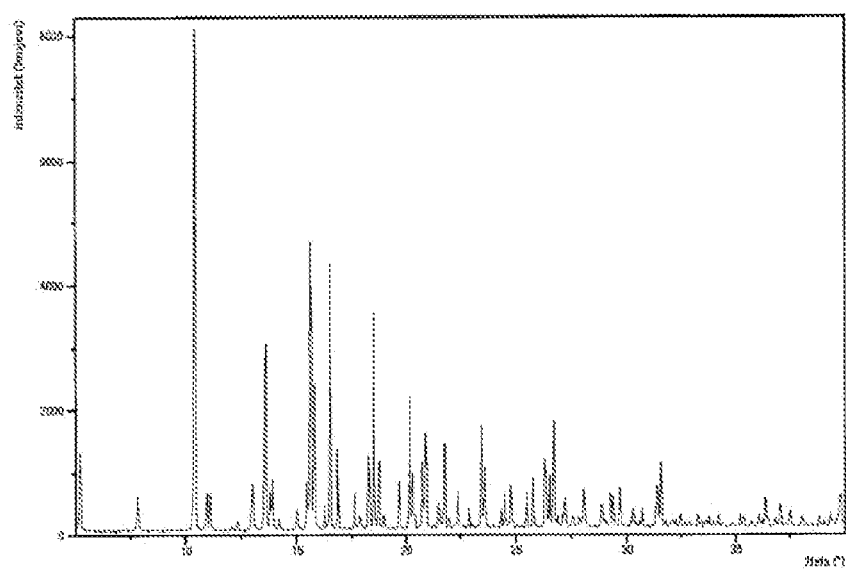
Slika 18

sol glutaminske kiseline 1:1 + monohidrat glutaminske kiseline



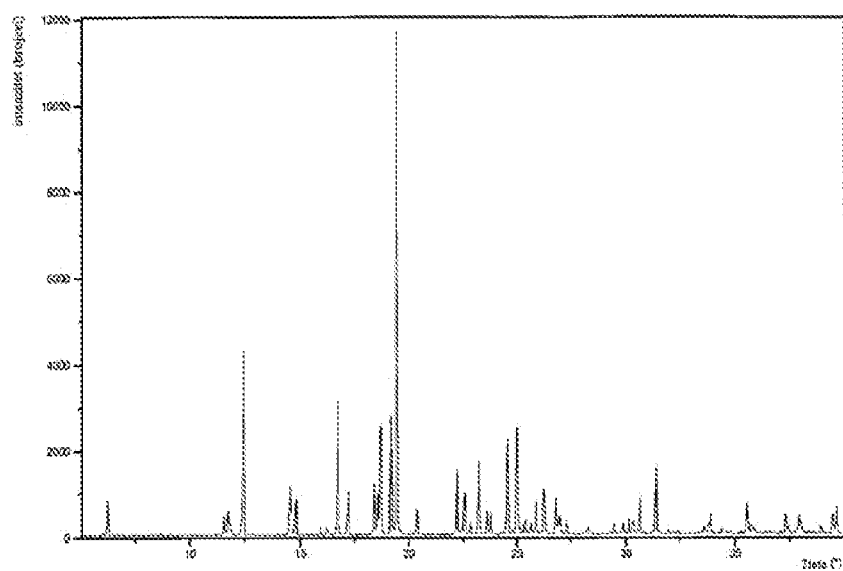
Slika 19

sol limunske kiseline 2:1



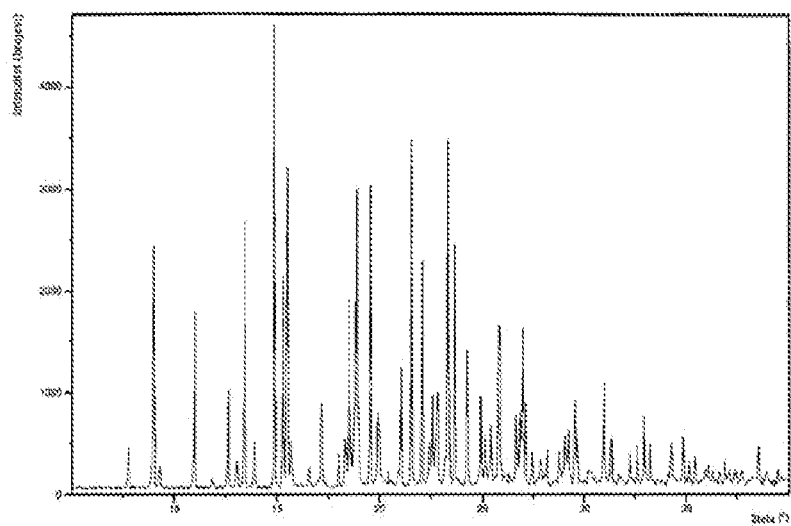
Slika 20

hidrokloridna sol

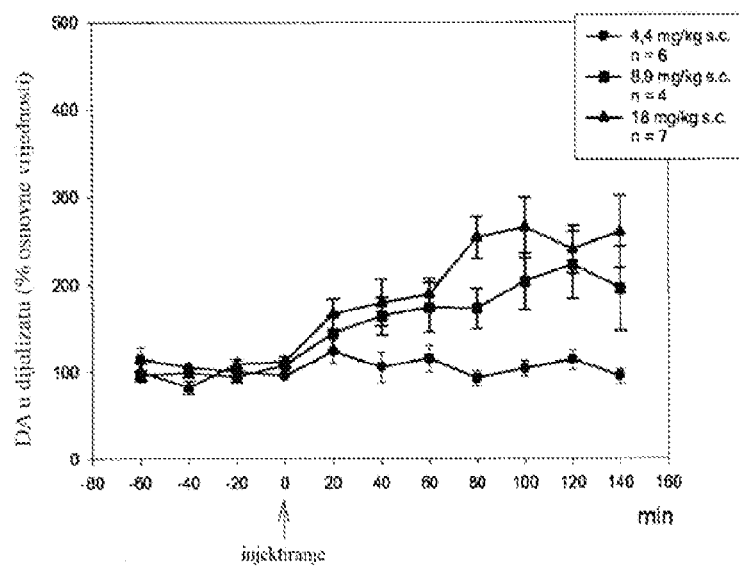


Slika 21

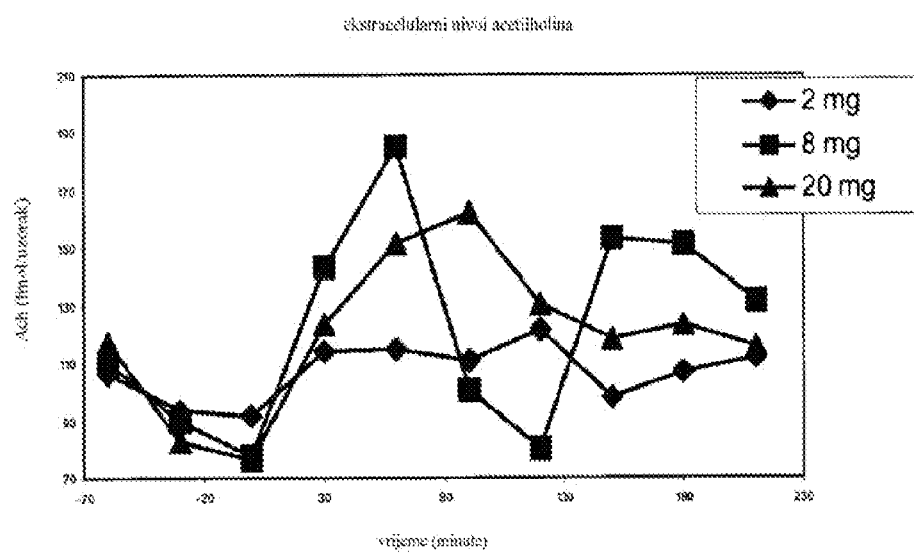
solfosforne kiseline 1:1



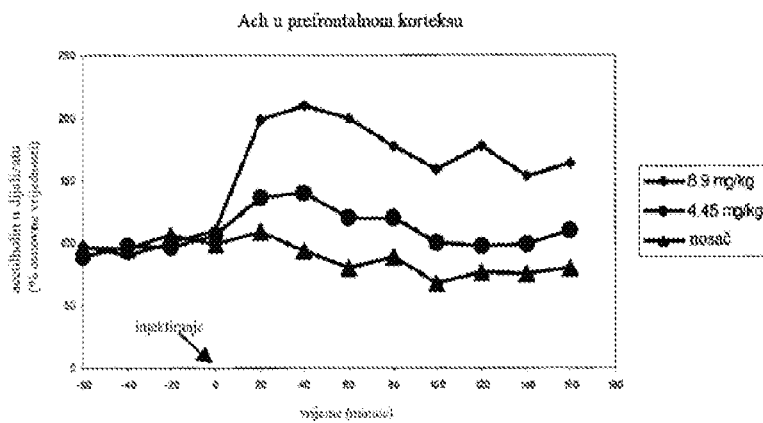
Slika 22



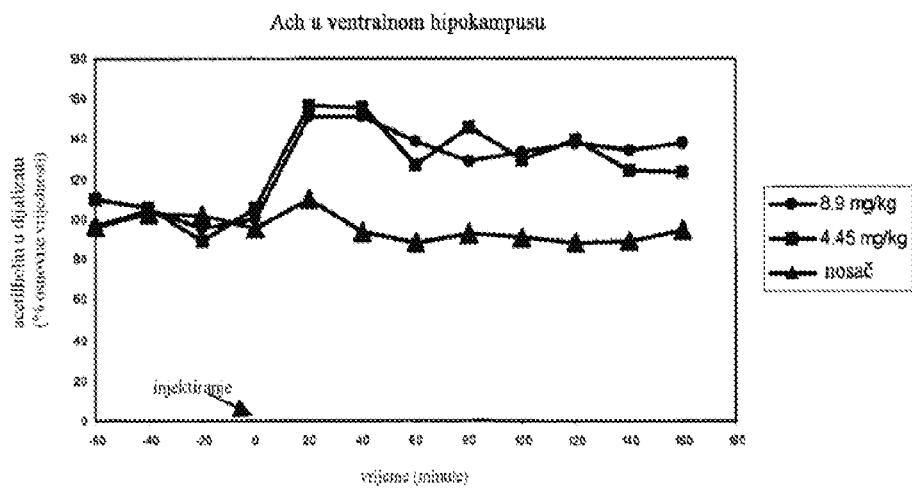
Slika 23



Slika 24



Slika 25a



Slika 25b