

6 Feb 07
200700886-5

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

BERICHTIGTE FASSUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



162162

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
23. Februar 2006 (23.02.2006)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/018222 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 475/00 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
C07D 211/58 (2006.01) A61K 31/519 (2006.01)

(74) Gemeinsamer Vertreter: BOEHRINGER INGEL-
HEIM INTERNATIONAL GMBH; Binger Strasse 173,
55216 Ingelheim (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/008736

(22) Internationales Anmeldedatum:

11. August 2005 (11.08.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

04019366.6 14. August 2004 (14.08.2004) EP

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von DE, US): BOEHRINGER INGELHEIM INTER-
NATIONAL GMBH [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216
Ingelheim (DE).

(71) Anmelder (nur für DE): BOEHRINGER INGELHEIM
PHARMA GMBH & CO. KG [DE/DE]; Binger Strasse
173, 55216 Ingelheim (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): LINZ, Guenter
[DE/DE]; Eschenweg 6, 88441 Mittelbiberach (DE).
SIEGER, Peter [DE/DE]; Klingenäcker 7, 88441 Mittel-
biberach (DE). KRAEMER, Gerd, F. [DE/DE]; Auenweg
38a, 88436 Eberhardzell (DE). RALL, Werner [DE/DE];
Beethovenstr. 33, 88441 Mittelbiberach (DE). HERTER,
Rolf [DE/DE]; Georg-Schinbain-Str. 62, 88400 Biberach
(DE). HOFFMANN, Matthias [DE/DE]; Sonnenweg 17,
88441 Mittelbiberach (DE). SCHMID, Rolf [DE/DE];
Talstrasse 37, 88487 Baltringen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA,
MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ,
OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC,
VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC,
NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(48) Datum der Veröffentlichung dieser berichtigten
Fassung: 15. Juni 2006

(15) Informationen zur Berichtigung:
siehe PCT Gazette Nr. 24/2006 vom 15. Juni 2006

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: HYDRATES AND POLYMORPHS OF 4-[(7R)-8-CYCLOPENTYL-7-ETHYL-5,6,7,8-TETRAHY-
DRO-5-METHYL-4-6-OXO-2-PIPERIDINYL]AMINO]-3-METHOXY-N-(1-METHYL-4-PIPERIDINYL) BENZAMIDE,
METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF, AND USE THEREOF AS MEDICAMENTS

(54) Bezeichnung: HYDRATE UND POLYMORPHE DES 4-[(7R)-8-CYCLOPENTYL-7-ETHYL-5,6,7,8-TETRAHY-
DRO-5-METHYL-4-6-OXO-2-PIPERIDINYL]AMINO]-3-METHOXY-N-(1-METHYL-4-PIPERIDINYL)-BENZAMID,
VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL

(57) Abstract: The invention relates to novel hydrates and novel polymorphs of 4-[(7R)-8-cyclopentyl-7-ethyl-5,6,7,8-tetrahy-
dro-5-methyl-6-oxo-2-pteridiny]amino]-3-methoxy-N-(1-methyl-4-piperidinyl) benzamide, methods for the production thereof, and
the use thereof as medicaments.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft neue Hydrate und neue Polymorphe des 4-[(7R)-8-Cyclopentyl-7-
ethyl-5,6,7,8-tetrahydro-5-methyl-6-oxo-2-pteridiny]amino]-3-methoxy-N-(1-methyl-4-piperidinyl)-benzamid, Verfahren zu deren
Herstellung und deren Verwendung als Arzneimittel.

WO 2006/018222 A1



ACTION