

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



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

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2006/018222 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 475/00**,
211/58, A61P 35/00, A61K 31/519

(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 (nur für AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BE, BF, BG, BJ, BR, BW, BY, BZ, CA, CF, CG, CH, CI, CM, CN, CO, CR, CU, CY, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, FR, GA, GB, GD, GE, GH, GM, GN, GQ, GR, GW, HR, HU, ID, IE, IL, IN, IS, IT, JP, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MC, MD, MG, MK, ML, MN, MR, MW, MX, MZ, NA, NE, NG, NI, NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG): **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL 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 Mittelbiberach (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).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH**; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim (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

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes 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-TETRAHYDRO-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-TETRAHYDRO-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-tetrahydro-5-methyl-6-oxo-2-pteridiny]amino]-3-methoxy-N-(1-methyl-4-piperidiny] 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-piperidiny] benzamid, Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung als Arzneimittel.



WO 2006/018222 A1