

ROYAUME DU MAROC

OFFICE MAROCAIN DE LA PROPRIETE (19)
INDUSTRIELLE ET COMMERCIALE



المملكة المغربية

المكتب المغربي
للملكية الصناعية والتجارية

(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 43397 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/495; A61P 25/18; C07D 295/096; A61P 25/28; C07D 207/28; A61P 25/24**
- (43) Date de publication : **28.02.2019**
-
- (21) N° Dépôt : **43397**
- (22) Date de Dépôt : **11.05.2016**
- (30) Données de Priorité : **13.05.2015 DK 201500284**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2016/060540 11.05.2016**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation:EP16721817.1
- (71) Demandeur(s) : **H. Lundbeck A/S, Ottiliavej 9 2500 Valby (DK)**
- (72) Inventeur(s) : **DE DIEGO, Heidi, Lopez ; CHRISTENSEN, Kim, Lasse ; HOLM, Rene ; KATEB, Jens**
- (74) Mandataire : **SABA&CO**
-
- (54) Titre : **PYROGLUTAMATE DE VORTIOXETINE**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne un sel de pyroglutamate de vortioxetine et des compositions pharmaceutiques comprenant ledit sel.

REVENDEICATIONS

1. Pyroglutamate de vortioxétine.
- 5 2. Composé selon la revendication 1, sélectionné à partir du (L)-pyroglutamate de vortioxétine, du (D)-pyroglutamate de vortioxétine et du (DL)-pyroglutamate de vortioxétine.
- 10 3. Composé selon la revendication 1, qui est le (L)-pyroglutamate de vortioxétine ou le (D)-pyroglutamate de vortioxétine sous forme cristalline avec des réflexions XRPD à 10,72, 12,14, 16,22 et 18,59 ($^{\circ}2\theta$) ($\pm 0,1^{\circ}2\theta$).
- 15 4. Composé selon la revendication 1, qui est le (DL)-pyroglutamate de vortioxétine monohydraté sous forme cristalline avec des réflexions XRPD à 6,16, 9,25, 17,68 et 18,12 ($^{\circ}2\theta$) ($\pm 0,1^{\circ}2\theta$).
- 20 5. Composé selon la revendication 1, qui est le (DL)-pyroglutamate de vortioxétine de forme α sous forme cristalline avec des réflexions XRPD à 14,27, 15,75, 17,06 et 18,59 ($^{\circ}2\theta$) ($\pm 0,1^{\circ}2\theta$).
- 25 6. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, destiné à être utilisé en thérapie.
7. Composition pharmaceutique comprenant un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5 conjointement avec au moins un véhicule ou un diluant acceptable du point de vue pharmaceutique.
- 30 8. Composition pharmaceutique gélifiable comprenant un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5 et un sel.
9. Gel comprenant un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, un sel et de l'eau.

10. Composition pharmaceutique solide destinée à une administration orale comprenant un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5 et un enrobage entérique.
- 5 11. Procédé de préparation d'un gel, ledit procédé comprenant un mélange d'un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, d'un sel et d'une solution aqueuse.
- 10 12. Utilisation d'un composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, pour l'obtention d'un médicament destiné à un traitement d'une maladie sélectionnée à partir d'un trouble dépressif majeur ; d'un épisode dépressif majeur ; d'un trouble d'anxiété générale ; d'un trouble obsessionnel compulsif (TOC) ; d'un trouble panique ; d'un syndrome de stress post-traumatique ; d'un trouble cognitif ; d'un trouble cognitif léger (MCI) ; d'un trouble cognitif associé à la maladie d'Alzheimer ; de la dépression ; de la schizophrénie (CIAS) ; et d'un trouble du déficit de l'attention avec hyperactivité (TDAH).
- 15 13. Utilisation d'un composé selon la revendication 12 et d'un sel pour l'obtention d'un médicament destiné à un traitement d'une maladie sélectionnée à partir d'un trouble dépressif majeur ; d'un épisode dépressif majeur ; d'un trouble d'anxiété générale ; d'un trouble obsessionnel compulsif (TOC) ; d'un trouble panique ; d'un syndrome de stress post-traumatique ; d'un trouble cognitif ; d'un trouble cognitif léger (MCI) ; d'un trouble cognitif associé à la maladie d'Alzheimer ; de la dépression ; de la schizophrénie (CIAS) ; et d'un trouble du déficit de l'attention avec hyperactivité (TDAH).
- 20 14. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, destiné à être utilisé dans une méthode permettant de traiter une maladie sélectionnée à partir d'un trouble dépressif majeur ; d'un épisode dépressif majeur ; d'un trouble d'anxiété générale ; d'un trouble obsessionnel compulsif (TOC) ; d'un trouble panique ; d'un syndrome de stress post-traumatique ; d'un trouble cognitif ; d'un trouble cognitif léger (MCI) ; d'un trouble cognitif associé à la maladie d'Alzheimer ; de la dépression ; de la schizophrénie (CIAS) ; et d'un trouble du déficit de l'attention avec hyperactivité (TDAH).
- 25 30 35 15. Composé selon la revendication 14 conjointement avec un sel, destiné à être utilisé dans une méthode permettant de traiter d'une maladie sélectionnée à partir d'un trouble dépressif majeur ; d'un épisode dépressif majeur ; d'un trouble d'anxiété générale ; d'un

trouble obsessionnel compulsif (TOC) ; d'un trouble panique ; d'un syndrome de stress post-traumatique ; d'un trouble cognitif ; d'un trouble cognitif léger (MCI) ; d'un trouble cognitif associé à la maladie d'Alzheimer ; de la dépression ; de la schizophrénie (CIAS) ; et d'un trouble du déficit de l'attention avec hyperactivité (TDAH).