



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2011126173/04, 09.12.2009

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
11.12.2008 US 61/121,668

(43) Дата публикации заявки: 20.01.2013 Бюл. № 2

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 11.07.2011(86) Заявка РСТ:
SG 2009/000473 (09.12.2009)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2010/068181 (17.06.2010)

Адрес для переписки:

190000, Санкт-Петербург, ул. Малая Морская,
15, оф. 5, ВОХ 1125, ООО "ПАТЕНТИКА",
М.И.Ниловой

(71) Заявитель(и):

ЭС БИО ПТИ ЛТД (SG)

(72) Автор(ы):

**ДИМОК Брайан (SG),
ЛИ Чэн Хсия Анджелиана (SG),
ВИЛЬЯМ Энтони Деодауния (SG)**(54) ЦИТРАТ 11-(2-ПИРРОЛИДИН-1-ИЛ-ЭТОКСИ)-14,19-ДИОКСА-5,7,26-ТРИАЗА-ТЕТРАЦИКЛО
[19.3.1.1(2,6).1(8,12)]ГЕПТАКОЗА-1-(25),2(26),3,5,8,10,12(27),16,21,23-ДЕКАЕНА

(57) Формула изобретения

1. Цитрат 11-(2-пирролидин-1-ил-этоксид)-14,19-диокса-5,7,26-триаза-тетрацикло
[19.3.1.1(2,6).1(8,12)]гептакоза-1(25),2(26),3,5,8,10,12(27),16,21,23 - декаена.

2. Соль по п.1, отличающаяся тем, что она является кристаллической.

3. Соль по п.2, отличающаяся тем, что является солью в пропорции 1:1.

4. Соль по п.2, отличающаяся тем, что ее дифракционная рентгенограмма имеет пик
при угле 2θ , равном $22.4^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$.5. Соль по п.4, отличающаяся тем, что ее дифракционная рентгенограмма
дополнительно имеет пики при углах 2θ , равных $10.2^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$ и $15.7^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$.6. Соль по любому из пп.1-5, отличающаяся тем, что ее дифракционная
рентгенограмма имеет по меньшей мере четыре пика при углах 2θ , выбранных из
группы, состоящей из $7.8^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $10.2^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $14.2^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $15.7^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $16.8^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $21.4^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$,
и $22.4^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$.7. Соль по п.6, отличающаяся тем, что ее дифракционная рентгенограмма имеет по
меньшей мере шесть пиков при углах 2θ , выбранных из группы, состоящей из $7.8^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$,
 $10.2^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $14.2^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $15.7^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $16.8^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $21.4^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, и $22.4^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$.8. Соль по п.6, отличающаяся тем, что ее дифракционная рентгенограмма имеет
пики при углах 2θ , равных $7.8^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $10.2^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $14.2^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $15.7^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$, $16.8^{\circ} \pm 0.5^{\circ}$,

21.4°±0.5°, и 22.4°±0.5°.

9. Соль по п.8, отличающаяся тем, что ее дифракционная рентгенограмма имеет пики при углах 2θ, равных 10.9°±0.5°, 17.1°±0.5°, 23.3°±0.5°, 25.1°±0.5°, 25.8°±0.5°, и 27.5°±0.5°.

10. Соль по п.9, отличающаяся тем, что ее дифракционная рентгенограмма имеет пики при углах 2θ, равных 7.2°±0.5°, 17.6°±0.5°, 18.5°±0.5°, 18.7°±0.5°, 20.7°±0.5°, 23.1°±0.5°, 24.2°±0.5°, 26.2°±0.5°, 26.9°±0.5°, 28.7°±0.5°, 29.3°±0.5°, 31.0°±0.5°, 32.4°±0.5°, 37.3°±0.5°, 38.6°±0.5°, 39.9°±0.5° и 41.6°±0.5°.

11. Фармацевтическая композиция, содержащая соль по любому из пп.1-10.

12. Способ лечения или предотвращения пролиферативных нарушений, включающий введение терапевтически эффективного количества соли по любому из пп.1-10 пациенту, нуждающемуся в таком лечении.

13. Способ по п.12, отличающийся тем, что пролиферативным нарушением является раковое заболевание.

14. Применение соли по любому из пп.1-10 при лечении пролиферативных нарушений.

15. Применение по п.14, отличающееся тем, что пролиферативным нарушением является раковое заболевание.

16. Применение соли по любому из пп.1-10 в производстве медикамента для лечения пролиферативных нарушений.

17. Применение по п.16, отличающееся тем, что пролиферативным нарушением является раковое заболевание.

RU 2011126173 A

RU 2011126173 A