



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012105044/04, 14.07.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
15.07.2009 US 61/225,609

(43) Дата публикации заявки: 20.08.2013 Бюл. № 23

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 15.02.2012(86) Заявка РСТ:  
SG 2010/000265 (14.07.2010)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/008172 (20.01.2011)

Адрес для переписки:

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

(71) Заявитель(и):

СЕЛЛ ТЕРАПЬЮТИКС, ИНК. (US)

(72) Автор(ы):

ДАЙМОК Брайан (SG),  
ЛИ Чэнь Хеия Анджелин (SG),  
ВИЛЬЯМ Энтони Деодония (SG)

(54) ЦИТРАТНАЯ СОЛЬ 9E-15-(2-ПИРРОЛИДИН-1-ИЛ-ЭТОКСИ)-7,12,25-ТРИОКСА-19,21,24-ТРИАЗАТЕТРАЦИКЛО[18.3.1.1(2,5).1(14,18)]ГЕКСАКОЗА-1(24),2,4,9,14,16,18(26),20,22-НОНАЕНА

## (57) Формула изобретения

1. Кристаллический цитрат 9E-15-(2-пирролидин-1-ил-этоксид)-7,12,25-триокса-19,21,24-триазатетрацикло[18.3.1.1(2,5).1(14,18)]гексакоза-1(24),2,4,9,14,16,18(26),20,22-нонаена.

2. Цитрат по п.1, отличающийся тем, что указанная соль представляет собой соль 1:1.

3. Цитрат по любому из пп.1 или 2, характеризующийся пиком рентгеновской дифракции при  $22,4^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$  по шкале 2-тета.4. Цитрат по п.3, также характеризующийся пиками рентгеновской дифракции при  $10,0^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $15,6^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $17,2^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$  по шкале 2-тета.5. Цитрат по п.1, характеризующийся по меньшей мере четырьмя пиками рентгеновской дифракции, выбранными из группы, состоящей из  $7,9^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $10,0^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $15,6^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $15,9^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $16,8^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $17,2^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $21,1^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$  и  $22,4^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$  по шкале 2-тета.6. Цитрат по п.4, характеризующийся по меньшей мере 6 пиками рентгеновской дифракции, выбранными из группы, состоящей из  $7,9^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $10,0^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $15,6^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $15,9^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $16,8^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $17,2^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $21,1^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$  и  $22,4^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$  по шкале 2-тета.7. Цитрат по п.5, характеризующийся пиками рентгеновской дифракции при  $7,9^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $10,0^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $15,6^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $15,9^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $16,8^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $17,2^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$ ,  $21,1^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$  и  $22,4^{\circ} \pm 0,5^{\circ}$  по шкале 2-тета.

8. Цитрат по п.7, также характеризующийся пиками рентгеновской дифракции при

11,1°±0,5°, 18,1°±0,5°, 21,8°±0,5°. 23,2°±0,5° и 27,6°±0,5° по шкале 2-тета.

9. Цитрат по п.8, также характеризующийся пиками рентгеновской дифракции при 7,0°±0,5°, 14,0°±0,5°, 19,0°±0,5°, 19,8°±0,5°, 23,6°±0,5°, 24,3°±0,5°, 25,2°±0,5°, 25,7°±0,5°, 26,1°±0,5°. 26,5°±0,5° и 32,1°±0,5° по шкале 2-тета.

10. Фармацевтическая композиция, содержащая цитрат по любому из пп.1-9.

11 Способ лечения или предотвращения пролиферативного расстройства, включающий введение нуждающемуся в этом пациенту терапевтически эффективного количества цитрата по любому из пп.1-9.

12 Способ по п.11, отличающийся тем, что пролиферативное расстройство представляет собой рак.

13 Применение цитрата по любому из пп.1-9 для лечения пролиферативного расстройства.

14 Применение по п.13, отличающееся тем, что пролиферативное расстройство представляет собой рак.

15. Применение цитрата по любому из пп.1-9 для получения лекарственного средства для лечения пролиферативного расстройства.

16. Применение по п.15, отличающееся тем, что пролиферативное расстройство представляет собой рак.

RU 2012105044 A

RU 2012105044 A