

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2014129930, 21.07.2014

Приоритет(ы):

(22) Дата подачи заявки: 21.07.2014

(43) Дата публикации заявки: 10.02.2016 Бюл. № 04

Адрес для переписки:

123242, Москва, Кудринская площадь, 1, а/я 35,
"Михайлюк, Сороколат и партнеры-патентные
поверенные"

(71) Заявитель(и):

ДИФАРМА ФРАНЦИС С.р.л. (ИТ)

(72) Автор(ы):

Эмануэле Аттолино (ИТ),

Андреа Мальвестити (ИТ)

(54) **ИМИНОСАХАР В КРИСТАЛЛИЧЕСКОЙ ФОРМЕ**

(57) Формула изобретения

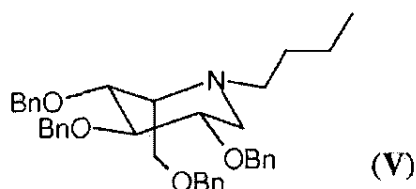
1. Миглустат, а именно N-бутил-1,5-дидезокси-1,5-имино-D-глюцит в кристаллической форме, называемый в данном документе форма I, характеризующийся XRPD-спектром, изображенным на фигуре 3, в котором наиболее интенсивные пики (выраженные в $2\theta^\circ$) должны обнаруживаться при 9,93, 11,82, 14,46, 15,84, 16,41, 17,76, 17,94, 19,41, 20,01, 20,79, 21,21, 22,14, 22,62, 23,40, 24,75, 26,04 и $30,27 \pm 0,2^\circ$ в 2θ ; и DSC-термограммой, изображенной на фигуре 4, которая имеет эндотермический пик при 129-130°C.

2. Миглустат в кристаллической форме I по п. 1, характеризующийся степенью химической чистоты равной или превышающей 98%.

3. Миглустат в кристаллической форме I по п. 1, характеризующийся степенью химической чистоты равной или превышающей 99%.

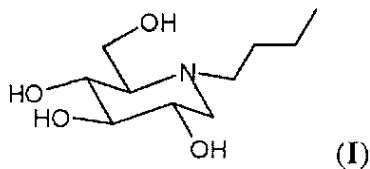
4. Миглустат в кристаллической форме I по п. 1, где кристаллы имеют значение D_{50} в диапазоне от приблизительно 25 до приблизительно 250 мкм.

5. Миглустат в кристаллической форме I по п. 1 в качестве API (активного фармацевтического ингредиента), содержащий соединение в идо-конфигурации формулы (V),

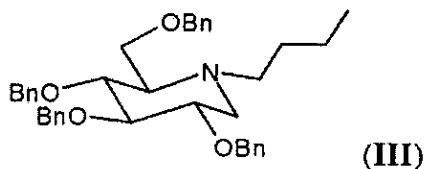


в количестве менее 0,1%, определенном с помощью ВЭЖХ.

6. Способ получения миглустата формулы (I) в кристаллической форме I по п. 1,



включающий использование в качестве исходного продукта соединения формулы (III) в кристаллической форме, в частности, в кристаллической форме А,



характеризующегося XRPD, изображенной на фигуре 1, где наиболее интенсивные пики (выраженные в $2\theta^\circ$) должны обнаруживаться при 4,83, 5,76, 6,96, 7,80, 13,08, 16,50, 17,97, 18,75, 19,14, $19,62 \pm 0,2^\circ$.

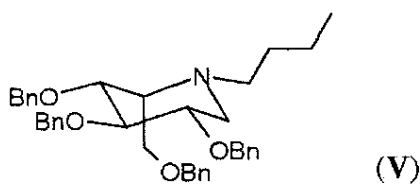
7. Способ получения миглустата в кристаллической форме I по п. 1 с помощью способа очистки, включающего:

- получение раствора миглустата в C_1 - C_5 алканоле с прямой или разветвленной цепью, предпочтительно метаноле или этаноле;
- добавление C_3 - C_7 кетона с прямой или разветвленной цепью, предпочтительно ацетона или метилэтилкетона;
- охлаждение смеси и
- извлечение твердого вещества.

8. Фармацевтическая композиция, содержащая миглустат в кристаллической форме I по п. 1 в качестве активного ингредиента и фармацевтически приемлемый носитель и/или разбавитель.

9. Фармацевтическая композиция по п. 8, где кристаллы миглустата имеют значение D_{50} в диапазоне от приблизительно 25 до приблизительно 250 мкм.

10. Фармацевтическая композиция, содержащая миглустат в кристаллической форме I по п. 1 в качестве активного ингредиента, соединение в идо-конфигурации формулы (V),



в количестве менее 0,1%, определенном с помощью ВЭЖХ, и фармацевтически приемлемый носитель и/или разбавитель.

11. Фармацевтическая композиция по п. 10, где кристаллы миглустата имеют значение D_{50} в диапазоне от приблизительно 25 до приблизительно 250 мкм.