



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2007129264/04, 25.01.2006

(30) Конвенционный приоритет:  
09.02.2005 US 60/651,374

(43) Дата публикации заявки: 20.03.2009 Бюл. № 8

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:  
10.09.2007(86) Заявка РСТ:  
US 2006/003098 (25.01.2006)(87) Публикация РСТ:  
WO 2006/086172 (17.08.2006)

Адрес для переписки:  
190068, Санкт-Петербург, ул. Садовая, 51,  
офис 303, ООО "ПАТЕНТИКА", пат.пов.  
М.И.Ниловой

(71) Заявитель(и):  
**ВАЙЕТ (US)**(72) Автор(ы):  
**ДЕШМАХ Сабодх С. (US)**(54) **ПОЛИМОРФ СС1-779 И ЕГО ПРИМЕНЕНИЕ**

## (57) Формула изобретения

1. Полиморф СС1-779, на рентгенограмме которого отсутствуют пики при значениях угла  $2\theta$  7.6, 9.5, 11.4, 15.0, 16.8, 18.2, 18.5 и 21.2.

2. Полиморф СС1-779 по п.1, отличающийся тем, что он представляет собой форму II, имеющую следующие характеристики:

(а) рентгенограмму, содержащую пики при значениях угла  $2\theta$ , 6.6, 9.8, 14.0, 14.1, 14.5 и 18.8; и

(b) термограмму, полученную методом дифференциальной сканирующей калориметрии, имеющую эндотермический пик при температуре примерно 110°C.

3. Полиморф СС1-779 формы II по п.1, отличающийся тем, что он демонстрирует при термогравиметрическом анализе потери в весе менее 1 вес.% при нагревании от 25 до 150°C.

4. Полиморф СС1-779 (форма II), получаемый путем осаждения вышеуказанного полиморфа СС1-779 формы II из суспензии, содержащей аморфный СС1-779 и трет-бутилметилловый эфир.

5. Способ получения полиморфа СС1-779 формы II, включающий стадии

(а) растворения СС1-779 в исходном растворителе;

(b) удаления вышеуказанного исходного растворителя, используемого на стадии (а), с образованием твердой пены;

(с) смешивание твердой пены с трет-бутилметилловым эфиром (трет-БМЭ); и

(d) сбор вышеуказанного полиморфа СС1-779 формы II.

6. Способ по п.5, отличающийся тем, что вышеуказанный исходный растворитель

представляет собой ацетон.

7. Способ по п.5 или 6, отличающийся тем, что трет-БМЭ добавляют в количестве, достаточном для образования твердой суспензии.

8. Способ по п.7, отличающийся тем, что он дополнительно включает стадию промывания суспензии трет-БМЭ и высушивания под вакуумом с получением формы II в виде сухого кристаллического твердого вещества.

9. Способ по п.5 или 6, отличающийся тем, что он дополнительно включает стадию смешивания н-гептана со смесью твердой пены с трет-БМЭ с образованием твердой суспензии.

10. Способ по п.9, отличающийся тем, что он дополнительно включает стадию сбора твердого вещества, промывания вышеуказанного твердого вещества н-гептаном и высушивания под вакуумом с получением формы II в виде сухого кристаллического твердого вещества.

11. Фармацевтическая композиция, содержащая полиморф СС1-779 формы II и фармацевтически приемлемый носитель.

12. Набор, содержащий полиморф СС1-779 формы II и носитель, подходящий для введения млекопитающему пациенту.

13. Способ приготовления фармацевтической композиции, содержащей полиморф СС1-779 формы II, включающий комбинирование одного или нескольких веществ из следующей группы:

- (i) полиморф СС1-779 формы II;
- (ii) хелатирующий агент для связывания металлов;
- (iii) регулятор pH;
- (iv) поверхностно-активное вещество;
- (v) по меньшей мере один наполнитель;
- (vi) связующее вещество;
- (vii) дезинтегратор; и
- (viii) смазывающее вещество.