



(51) МПК
C07D 401/14 (2006.01)
B82B 3/00 (2006.01)
B82Y 40/00 (2011.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 35/02 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2020113897, 17.04.2020

Приоритет(ы):

(22) Дата подачи заявки: 17.04.2020

(43) Дата публикации заявки: 18.10.2021 Бюл. № 29

Адрес для переписки:

125009, Москва, а/я 95, Москалев Евгений
 Андреевич

(71) Заявитель(и):

Общество с ограниченной ответственностью
 «АксельФарм» (RU)

(72) Автор(ы):

Торчинов Георгий Юрьевич (RU)

(54) **НАНОКРИСТАЛЛИЧЕСКАЯ ФОРМА 4-МЕТИЛ-N-[3-(4-МЕТИЛИМИДАЗОЛ-1-ИЛ)-5-(ТРИФТОРМЕТИЛ)ФЕНИЛ]-3-[(4-ПИРИДИН-3-ИЛПИРИМИДИН-2-ИЛ)АМИНО]БЕНЗАМИДА ГИДРОХЛОРИДА МОНОГИДРАТА (ВАРИАНТЫ), СПОСОБ ЕЁ ПОЛУЧЕНИЯ И ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ИММУНОЛОГИЧЕСКИХ ИЛИ ОНКОЛОГИЧЕСКИХ ЗАБОЛЕВАНИЙ**

(57) Формула изобретения

1. Нанокристаллическая форма 4-метил-N-[3-(4-метилимидазол-1-ил)-5-(трифторметил)фенил]-3-[(4-пиридин-3-илпиримидин-2-ил)амино]бензамида гидрохлорида моногидрата, отличающаяся тем, что она характеризуется средним размером частиц 261 ± 10 нм и набором сигналов в спектре порошковой рентгеновской дифракции при значениях угла 2θ , равных 8,42; 11,84; 19,52 и $25,76 \pm 0,2$ градуса.

2. Способ получения нанокристаллической формы 4-метил-N-[3-(4-метилимидазол-1-ил)-5-(трифторметил)фенил]-3-[(4-пиридин-3-илпиримидин-2-ил)амино]бензамида гидрохлорида моногидрата, отличающийся тем, что он включает следующие стадии:

а). приготовление расплава сырьевого 4-метил-N-[3-(4-метилимидазол-1-ил)-5-(трифторметил)фенил]-3-[(4-пиридин-3-илпиримидин-2-ил)амино]бензамида гидрохлорида моногидрата, D-фруктозы и мочевины при массовом соотношении компонентов 1 : 2 : 3,5, соответственно, и температуре $60 \pm 3^\circ\text{C}$;

б). добавление в полученный расплав воды;

с). перемешивание полученной суспензии при температуре $20 \pm 3^\circ\text{C}$ в течение примерно 1 часа;

д). выделение из полученной суспензии твердого продукта при помощи фильтрации;

е). высушивание до постоянной массы под вакуумом при температуре $+40 \pm 3^\circ\text{C}$.

3. Способ по п.2, отличающийся тем, что перед приготовлением расплава сырьевой 4-метил-N-[3-(4-метилимидазол-1-ил)-5-(трифторметил)фенил]-3-[(4-пиридин-3-илпиримидин-2-ил)амино]бензамида гидрохлорида моногидрат получают химическим синтезом с использованием 4-метил-3-[4-(3-пиридинил)-2-пиримидил]-аминобензойной кислоты и 3-(трифторметил)-5-(4-метил-1*H*-имидазола-1-ил)анилина в качестве сырья и, 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодиимида гидрохлорида и *N*-гидроксиимидного соединения в качестве реагентов.

4. Применение нанокристаллической формы 4-метил-N-[3-(4-метилимидазол-1-ил)-5-(трифторметил)фенил]-3-[(4-пиридин-3-илпиримидин-2-ил)амино]бензамида гидрохлорида моногидрата по п. 1 для приготовления фармацевтической композиции для лечения иммунологических или онкологических заболеваний.

5. Фармацевтическая композиция для лечения иммунологических и/или онкологических заболеваний, содержащая нанокристаллическую форму 4-метил-N-[3-(4-метилимидазол-1-ил)-5-(трифторметил)фенил]-3-[(4-пиридин-3-илпиримидин-2-ил)амино]бензамида гидрохлорида моногидрата по п. 1 в сочетании с фармацевтически приемлемыми вспомогательными веществами.

RU 2020110202 A 2020110202 7683110202 A

RU 2020113897 A