



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012136378/04, 07.01.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
04.02.2010 CN 201010109068.5

(43) Дата публикации заявки: 10.03.2014 Бюл. № 7

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 04.09.2012(86) Заявка РСТ:  
CN 2011/070076 (07.01.2011)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/095068 (11.08.2011)Адрес для переписки:  
191186, Санкт-Петербург, а/я 230, "АРС-  
ПАТЕНТ", пат. пов. В.В.Дощечкиной

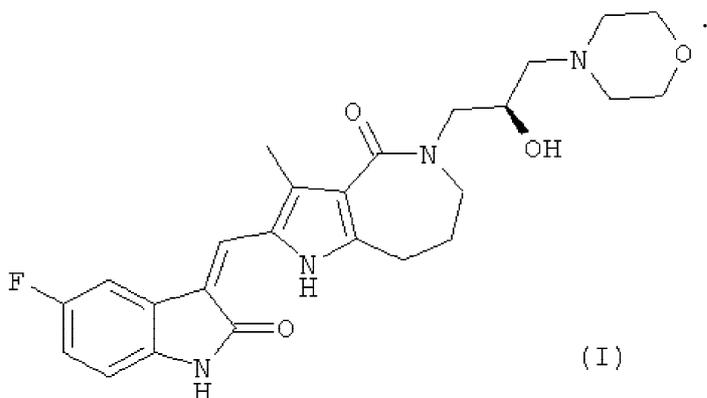
(71) Заявитель(и):

**ЦЗЯНСУ ХЭНЖУЙ МЕДИЦИН КО.,  
ЛТД. (CN),  
ШАНХАЙ ХЭНЖУЙ  
ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД. (CN)**

(72) Автор(ы):

**ТАН Пэн Чо (CN)****(54) ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИ ПРИЕМЛЕМЫЕ СОЛИ ПИРРОЛО-АЗОТИСТЫХ  
ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ ПРОИЗВОДНЫХ, СПОСОБ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ И МЕДИЦИНСКОЕ  
ПРИМЕНЕНИЕ****(57) Формула изобретения**

1. Фармацевтически приемлемая соль (R,Z)-2-(5-фтор-2-оксо-1,2-дигидроиндол-3-илиденметил)-5-(2-гидрокси-3-морфолин-4-илпропил)-3-метил-5,6,7,8-тетрагидро-1H-пирроло[3,2-c]азепин-4-она формулы (I):



2. Соль по п.1, которая представляет собой неорганическую соль.

3. Соль по п.2, где неорганическая соль выбрана из группы, состоящей из фосфата, гидрохлорида, сульфата, нитрата и гидробромида, предпочтительно гидрохлорида.

4. Соль по п.1, которая представляет собой органическую соль.

5. Соль по п.4, где органическая соль выбрана из группы, состоящей из мезилата, малеата, тартрата, сукцината, ацетата, трифторацетата, фумарата, цитрата, бензолсульфоната, бензоата, нафталинсульфоната, лактата и малата; предпочтительно малата, лактата, мезилата или малеата, наиболее предпочтительно малеата.

6. Способ получения соли по любому из пп.1-5, включающий стадию взаимодействия (R,Z)-2-(5-фтор-2-оксо-1,2-дигидроиндол-3-илиденметил)-5-(2-гидрокси-3-морфолин-4-илпропил)-3-метил-5,6,7,8-тетрагидро-1H-пирроло[3,2-c]азепин-4-она с соответствующей кислотой с получением соли.

7. Способ по п.6, где кислота представляет собой неорганическую кислоту или органическую кислоту, выбранную из группы, состоящей из фосфорной кислоты, соляной кислоты, серной кислоты, азотной кислоты, бромисто-водородной кислоты, метансульфоновой кислоты, малеиновой кислоты, винной кислоты, янтарной кислоты, уксусной кислоты, трифторуксусной кислоты, фумаровой кислоты, лимонной кислоты, бензолсульфоновой кислоты, бензойной кислоты, нафталинсульфоновой кислоты, молочной кислоты и яблочной кислоты.

8. Фармацевтическая композиция, содержащая терапевтически эффективное количество соли по любому из пп.1-5 и фармацевтически приемлемый носитель.

9. Применение соли по любому из пп.1-5 или фармацевтической композиции по п.8 для получения лекарственного средства для лечения заболевания, обусловленного протеинкиназой.

10. Применение по п.9, где заболевание, обусловленное протеинкиназой, выбрано из группы, состоящей из заболевания, обусловленного VEGFR-2, EGFR, HER-2, PDGFR, c-Kit, c-Met и FGFR.

11. Применение по п.10, где заболевание представляет собой рак.

12. Применение по п.11, где рак выбран из группы, состоящей из рака легкого, рака молочной железы, эпидермальной чешуйчато-клеточной карциномы и рака ЖКТ.

13. Применение соли по любому из пп.1-5 или фармацевтической композиции по п.8 для получения лекарственного средства, являющегося ингибитором протеинкиназы, где протеинкиназа выбрана из группы, состоящей из VEGFR-2, EGFR, HER-2, PDGFR, c-Kit, c-Met и FGFR.

---

#### FA9A Признание заявки на изобретение отозванной

Заявка признана отозванной в связи с непредставлением в установленный срок ходатайства о проведении экспертизы заявки по существу

Дата, с которой заявка признана отозванной: 11.01.2014

Дата публикации: 10.03.2014

---