

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

(21)(22) Заявка: 2020114890, 27.09.2018

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
27.09.2017 IN 201741034292

(43) Дата публикации заявки: 27.10.2021 Бюл. № 30

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 27.04.2020(86) Заявка РСТ:  
IB 2018/057484 (27.09.2018)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2019/064214 (04.04.2019)Адрес для переписки:  
197101, Санкт-Петербург, а/я 128, "АРС-  
ПАТЕНТ", М.В. Хмара

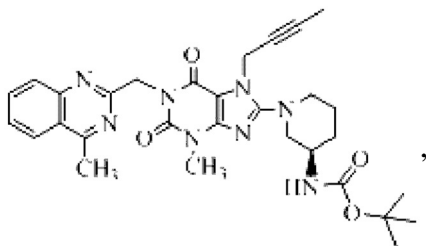
(71) Заявитель(и):

**БИОКОН ЛИМИТЕД (IN)**

(72) Автор(ы):

**ПАЛЛЕ, Венката, Рагхавендрачарьюлу (IN),  
РАДЖМАХЕНДРА, Шанмугхасами (IN),  
ЧАНДРЕГОВДА, Дхаршан, Джаккали (IN),  
ПОННУСАМИ, Тангарасу (IN)**(54) **КРИСТАЛЛИЧЕСКОЕ ПРОМЕЖУТОЧНОЕ СОЕДИНЕНИЕ, ИСПОЛЬЗУЕМОЕ ДЛЯ  
ПОЛУЧЕНИЯ ЛИНАГЛИПТИНА, И СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ЛИНАГЛИПТИНА**

(57) Формула изобретения

1. Кристаллическая форма В1 промежуточного соединения формулы V, используемого  
для получения линаглиптина,**Формула-V**охарактеризованная картиной дифракции рентгеновских лучей на порошке (XPRD),  
которая соответствует Фиг. 1.2. Кристаллическая форма В1 промежуточного соединения формулы V, используемого  
для получения линаглиптина, по п. 1, имеющая главные пики при  $3,14 \pm 0,2$ ;  $6,31 \pm 0,2$ ;  
 $8,34 \pm 0,2$ ;  $10,93 \pm 0,2$ ;  $13,75 \pm 0,2$  и  $14,46 \pm 0,2$  градуса  $2\theta$ .3. Кристаллическая форма В1 промежуточного соединения формулы V, используемого  
для получения линаглиптина, по п. 1, имеющая эндотермы дифференциальной  
сканирующей калориметрии (DSC) при  $53,87$  и  $162,97^\circ\text{C}$ .

4. Способ получения кристаллической формы В1 промежуточного соединения формулы V, используемого для получения линаглиптина, включающий следующие стадии, на которых:

а) нагревают неочищенное промежуточное соединение формулы V, используемое для получения линаagliптина, в растворителе;

б) добавляют подходящий антирастворитель к реакционной массе с приведенной выше стадии при повышенной температуре;

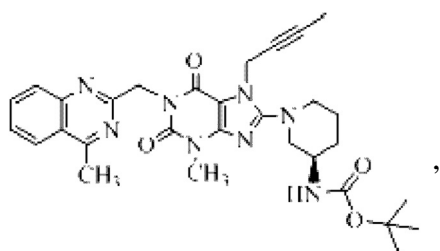
с) нагревают реакционную массу до повышенной температуры; и

d) охлаждают реакционную массу и выделяют кристаллическую форму промежуточного соединения формулы V, используемого для получения линаглиптина.

5. Способ получения по п. 4, где растворителем является ацетонитрил.

6. Способ получения по п. 4, где антирастворителем является вода.

7. Кристаллическая форма B2 промежуточного соединения формулы V, используемого для получения линаглиптина.



#### Формула-V

охарактеризованная картиной XPRD, которая соответствует Фиг. 4.

8. Кристаллическая форма В2 промежуточного соединения формулы V, используемого для получения линаagliптина, по п. 7, имеющая главные пики при  $3,43 \pm 0,2$ ;  $8,10 \pm 0,2$ ;  $9,96 \pm 0,2$  и  $17,02 \pm 0,2$  градуса  $2\theta$ .

9. Кристаллическая форма В2 промежуточного соединения формулы V, используемого для получения линаagliптина, по п. 7, имеющая эндотерму DSC при 168,69°C.

10. Способ получения кристаллической формы B2 промежуточного соединения формулы V, используемого для получения линаглиптина, включающий следующие стадии:

а) обрабатывают неочищенное промежуточное соединение формулы V, используемое для получения линаглиптина, предварительно нагретым растворителем;

б) добавляют антирастворитель к реакционной массе с приведенной выше стадии;

с) нагревают реакционную массу до повышенной температуры; и

d) охлаждают реакционную массу и выделяют кристаллическую форму промежуточного соединения формулы V, используемого для получения линаглиптина.

11. Способ получения по п. 10, где растворителем является ацетонитрил.

12. Способ получения по п. 10, где антирастворителем является вода.