

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012136921/04, 17.02.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
18.02.2010 US 61/305,581

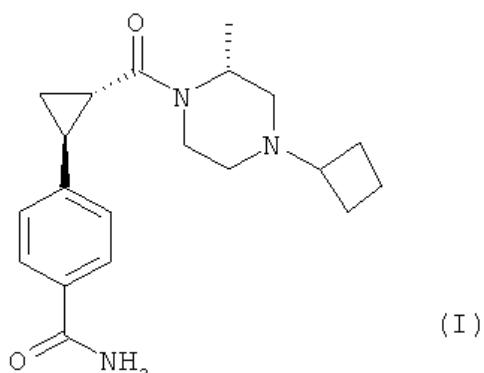
(43) Дата публикации заявки: 27.03.2014 Бюл. № 9

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 18.09.2012(86) Заявка РСТ:
SE 2011/050170 (17.02.2011)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/102793 (25.08.2011)Адрес для переписки:
191036, Санкт-Петербург, а/я 24, "НЕВИНПАТ"(71) Заявитель(и):
АстраЗенека АБ (SE)(72) Автор(ы):
КОЛЛИНС Крейг Д. (US)A
RU 2012136921 A

(54) ТВЕРДЫЕ ФОРМЫ, СОДЕРЖАЩИЕ ПРОИЗВОДНЫЕ ЦИКЛОСИЛАМИДА

(57) Формула изобретения

1. Твердая форма, содержащая Форму I соединения I:



2. Твердая форма по п.1, имеющая картину дифракции рентгеновских лучей на порошке (XRPD), содержащую по меньшей мере один пик при значении угла 2-тета (2θ), выбранном из примерно 5,3, примерно 8,5 и примерно 18,0 °2θ, при измерении с использованием излучения с длиной волны примерно 1,54 ангстрем.

3. Твердая форма по п.1, имеющая XRPD-картину, содержащую по меньшей мере два пика при 2θ, выбранных из примерно 5,3, примерно 8,5 и примерно 18,0 °2θ, при измерении с использованием излучения с длиной волны примерно 1,54 ангстрем.

4. Твердая форма по п.1, имеющая XRPD-картину, содержащую пики при примерно 5,3, примерно 8,5 и примерно 18,0 °2θ, при измерении с использованием излучения с

R U
2 0 1 2 1 3 6 9 2 1
A

длиной волны примерно 1,54 ангстрем.

5. Твердая форма по п.2, где данная картина дополнительно содержит пики при примерно 16,3 и примерно 19,3 °2θ.

6. Твердая форма по п.2, где данная картина дополнительно содержит пики при примерно 20,9 и примерно 21,4°2θ.

7. Твердая форма по п.1, имеющая XRPD-картину, содержащую пики в следующих десяти положениях: примерно 5,3, примерно 8,5, примерно 10,6, примерно 15,5, примерно 16,3, примерно 18,0, примерно 18,4, примерно 19,3, примерно 20,9, примерно 21,4 °2θ, при измерении с использованием излучения с длиной волны примерно 1,54 ангстрем.

8. Твердая форма по п.1, имеющая XRPD-картину, по существу, как изображено на Фиг.1.

9. Твердая форма по п.1, имеющая термограмму дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC), по существу, как изображено на Фиг.2.

10. Твердая форма по п.1, имеющая DSC-термограмму, содержащую эндотерму при примерно 133,5°C.

11. Твердая форма по п.1, имеющая термограмму термогравиметрического анализа (TGA), по существу, как изображено на Фиг.3.

12. Твердая форма по п.1, имеющая TGA-термограмму, соответствующую потере массы менее чем примерно 1% в диапазоне от примерно 20°C до примерно 100°C.

13. Твердая форма по п.12, где потеря массы составляет менее чем примерно 0,5%.

14. Твердая форма по п.12 или 13, где потеря массы составляет примерно 0,25%.

15. Твердая форма по п.1, которая является, по существу, кристаллической.

16. Твердая форма по п.1, которая является, по существу, чистой.

17. Твердая форма по п.1, которая является, по существу, кристаллической и, по существу, чистой.

18. Фармацевтическая композиция, содержащая твердую форму по любому из пп.1-17 в смеси с фармацевтически приемлемым носителем или разбавителем.

19. Фармацевтическая композиция по п.18 для применения в качестве лекарственного средства.

20. Твердая форма по любому из пп.1-17 для применения в качестве лекарственного средства.

21. Твердая форма по любому из пп.1-17 для применения в изготовлении лекарственного средства для лечения расстройства, выбранного из шизофрении, нарколепсии, избыточной дневной сонливости, ожирения, синдрома дефицита внимания с гиперактивностью, боли, болезни Альцгеймера, когнитивной недостаточности и когнитивной недостаточности при шизофрении.

22. Способ лечения расстройства, выбранного из шизофрении, нарколепсии, избыточной дневной сонливости, ожирения, синдрома дефицита внимания с гиперактивностью, боли, болезни Альцгеймера, когнитивной недостаточности и когнитивной недостаточности при шизофрении, у теплокровного животного, включающий введение указанному животному, нуждающемуся в таком лечении, терапевтически эффективного количества твердой формы по любому из пп.1-17.

23. Способ лечения расстройства, выбранного из шизофрении, нарколепсии, избыточной дневной сонливости, ожирения, синдрома дефицита внимания с гиперактивностью, боли, болезни Альцгеймера, когнитивной недостаточности и когнитивной недостаточности при шизофрении, у теплокровного животного, включающий введение указанному животному, нуждающемуся в таком лечении, фармацевтической композиции по п.18.

24. Твердая форма по любому из пп.1-17 для применения в лечении шизофрении, нарколепсии, избыточной дневной сонливости, ожирения, синдрома дефицита внимания

R U 2 0 1 2 1 3 6 9 2 1 A

R U 2 0 1 2 1 3 6 9 2 1 A

с гиперактивностью, боли, болезни Альцгеймера, когнитивной недостаточности или когнитивной недостаточности при шизофрении.

25. Фармацевтическая композиция по п.18 для применения в лечении шизофрении, нарколепсии, избыточной дневной сонливости, ожирения, синдрома дефицита внимания с гиперактивностью, боли, болезни Альцгеймера, когнитивной недостаточности или когнитивной недостаточности при шизофрении.