



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(51) МПК

C07D 473/18 (2006.01)

A61K 31/522 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01)

A61P 7/02 (2006.01)

A61P 19/00 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

A61P 37/08 (2006.01)

A61P 37/02 (2006.01)

## (12) ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21)(22) Заявка: 2014126396, 28.11.2012

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:  
28.11.2012Дата регистрации:  
12.04.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
29.11.2011 JP 2011-259662

(43) Дата публикации заявки: 27.01.2016 Бюл. № 3

(45) Опубликовано: 12.04.2017 Бюл. № 11

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 27.06.2014(86) Заявка РСТ:  
JP 2012/080769 (28.11.2012)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2013/081016 (06.06.2013)Адрес для переписки:  
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО  
"Союзпатент"

(72) Автор(ы):

ЯМАМОТО Синго (JP),  
ЁСИДЗАВА Тосио (JP)

(73) Патентообладатель(и):

ОНО ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД. (JP)

(56) Список документов, цитированных в отчете  
о поиске: WO 2008121742 A2, 09.10.2008 &  
EA 017865 B1, 29.03.2013. WO 2010009342 A2,  
21.01.2010 . US 2008076921 A1, 27.03.2008 &  
EA 024255 B1, 31.08.2016. WO 2011152321 A1,  
08.12.2011 & EP2578585 A1, 10.04.2013 & RU  
2575340 C2, опубл. 20.02.2016, приоритет  
31.05.2010.

## (54) ГИДРОХЛОРИД ПРОИЗВОДНОГО ПУРИНОНА

## (57) Формула изобретения

1. Гидрохлорид 6-амино-9-[(3R)-1-(2-бутиноил)-3-пирролидинил]-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-она.

2. Кристаллы гидрохлорида 6-амино-9-[(3R)-1-(2-бутиноил)-3-пирролидинил]-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8Н-пурин-8-она, имеющие на порошковой дифракционной рентгенограмме по меньшей мере 2 или больше пиков при углах 2θ, выбранных из примерно 8,11, 8,43, 11,57, 12,73, 13,85, 14,20, 14,67, 14,91, 15,94, 16,64, 18,06, 19,74, 20,42, 21,05, 22,57, 23,21, 23,85 и 24,70 градусов.

3. Кристаллы по п. 2, имеющие на порошковой дифракционной рентгенограмме пики при углах 2θ, выбранных из примерно 8,11, 8,43, 11,57, 12,73, 13,85, 14,20, 14,67, 14,91, 15,94, 16,64, 18,06, 19,74, 20,42, 21,05, 22,57, 23,21, 23,85 и 24,70 градусов.

4. Кристаллы по п. 2 или 3, характеризующиеся порошковой дифракционной рентгенограммой, приведенной на фиг. 3.

5. Кристаллы по п. 2, имеющие эндотермический пик при температуре пика 216°C

при исследовании методом дифференциальной сканирующей калориметрии.

6. Кристаллы по п. 2 или 5, характеризующиеся графиком дифференциальной сканирующей калориметрии, приведенным на фиг. 4.

7. Фармацевтическая композиция, являющаяся ингибитором тирозинкиназы Брутона (Btk), содержащая гидрохлорид 6-амино-9-[(3R)-1-(2-бутиноил)-3-пирролидинил]-7-(4-феноксифенил)-7,9-дигидро-8H-пурин-8-она.

8. Фармацевтическая композиция по п. 7 для применения в качестве средства для профилактики и/или лечения связанных с Btk заболеваний.

9. Фармацевтическая композиция по п. 8, где связанное с Btk заболевание является аллергическим заболеванием, аутоиммунным заболеванием, воспалительным заболеванием, тромбоэмболическим заболеванием, костным заболеванием или злокачественным новообразованием.

10. Фармацевтическая композиция по п. 9, где злокачественное новообразование является неходжкинской лимфомой.

RU 2 6 1 5 9 9 9 C 2

RU 2 6 1 5 9 9 9 C 2