

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2022101542, 13.06.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

13.06.2016 US 62/349, 582

(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,
из которой данная заявка выделена:
2018146423 26.12.2018

(43) Дата публикации заявки: 03.02.2022 Бюл. № 4

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

САЙНЬЮРЕКС ИНТЕРНЭШНЛ
(ТАЙВАНЬ) КОРП. (CN)

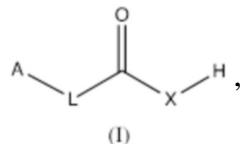
(72) Автор(ы):

ТСАЙ, Гочуань Эмиль (US),
ВАН, Чин-Чэн (CN),
СИЕХ, Тиен-Лан (CN),
ЛО, Юань-Чунь (CN)

(54) СОКРИСТАЛЛЫ БЕНЗОАТА ЛИТИЯ И ИХ ПРИМЕНЕНИЯ

(57) Формула изобретения

1. Сокристалл соединения бензоата лития и сокомпонента, в котором сокомпонент выбран из соединения Формулы(I)

где L обозначает C₁₋₃ алкил, C=C, C=C-C=C или отсутствует;

А обозначает метил, пиридинил, фенил, циклогексил, замещенный -CN, индолил или пирролил; и

Х обозначает O;

где соединение бензоата лития и сокомпонент существуют в сокристалле в молекулярном соотношении 1:5, 1:2 или 1:1; при условии, что когда L отсутствует, А не является фенилом.

2. Сокристалл по п.1, в котором L представляет собой C=C-C=C, А представляет собой метил и X представляет собой O, где соединение бензоата лития и сокомпонент существуют в сокристалле в молекулярном соотношении 1:2, и где сокристалл характеризуется порошковой рентгеновской дифрактограммой (XRPD) с пиками (°): 6,0; 6,7; 11,0; 11,4; 13,0; 13,3; 16,1; 16,7; 17,5; 18,2; 18,5; 20,5; 21,2; 22,4; 22,8; 23,5; 24,2; 24,8; 25,2; 26,8; 27,8.

3. Сокристалл по п. 1, отличающийся тем, что L отсутствует, А представляет собой пиридинил, а X представляет собой O, где соединение бензоата лития и сокомпонент присутствуют в сокристалле в молекулярном соотношении 1:1, и где сокристалл

A
RU 2022101542 A

R U 2 0 2 2 1 0 1 5 4 2 A

характеризуется порошковой рентгеновской дифрактограммой (XRPD) с пиками (°): 6,5; 11,1; 13,1; 15,5; 16,7; 17,5; 18,4; 19,7; 20,3; 20,7; 21,2; 21,6; 22,3; 22,8; 24,4; 24,8; 25,9; 26,9; 28,0; 28,7; 29,2; 30,0; 30,6; 31,6; 32,3; 33,6; 34,1; 35,8; 36,3; 37,2; 38,3; 39,1; 39,9; 41,2; 41,8; 42,8; и эндотермическим пиком, соответствующим температуре плавления около 165°C.

4. Фармацевтическая композиция для лечения нарушения центральной нервной системы (CNS), включающая эффективное количество сокристалла по любому из пп. 1-3 и носитель, где CNS нарушение выбрано из группы, состоящей из шизофрении, болезни Альцгеймера, деменции, легких когнитивных нарушений, расстройств аутического спектра, нарушения дефицита внимания и гиперактивности, обсессивно-компульсивного расстройства, биполярных расстройств, расстройств, связанных с болезнью Паркинсона, болезни Гентингтона, тревожного расстройства, серьезного депрессивного расстройства и бокового амиотрофического склероза.

5. Способ лечения или снижения риска нарушения центральной нервной системы (CNS) у пациента, включающий введение пациенту терапевтически эффективного количества сокристалла по любому из пп. 1-3 или композиции по п.4, где CNS нарушение выбрано из группы, состоящей из шизофрении, болезни Альцгеймера, деменции, легких когнитивных нарушений, расстройств аутического спектра, нарушения дефицита внимания и гиперактивности, обсессивно-компульсивного расстройства, биполярных расстройств, расстройств, связанных с болезнью Паркинсона, болезни Гентингтона, тревожного расстройства, серьезного депрессивного расстройства и бокового амиотрофического склероза.

6. Способ получения сокристалла по любому из пп. 1-3, включающий

(i) смешивание соединения бензоата лития и сокомпонента в растворителе при температуре примерно 40-110 °C с образованием насыщенного раствора, где молярное соотношение соединения бензоата лития и сокомпонента составляет от 1:10 до 10:1;

(ii) нагревание и перемешивание раствора при температуре около 70-150°C для образования сокристалла; и

сбор сокристалла, образованного в (ii);

где растворитель представляет собой воду, метанол, этанол, уксусную кислоту, диметилсульфоксид (ДМСО), тетрагидрофуран (ТГФ) или диэтиловый эфир.

7. Способ по п.6, в котором стадию (i) осуществляют путем добавления растворителя по каплям в соединение бензоата лития и сокомпонент и перемешивания таким образом сформированной смеси для обеспечения растворения соединения бензоата лития и сокомпонента в растворителе.

8. Способ по п. 6 или 7, отличающийся тем, что

(a) молярное соотношение на стадии (i) составляет 1:1 или 1:2;

(b) температура на этапе (i) составляет 65°C;

(c) температура на стадии (ii) составляет 75°C; и/или

(d) растворитель - метанол.