

Федеральная служба по интеллектуальной
собственности

Федеральное государственное бюджетное
учреждение



"Федеральный институт
промышленной собственности"
(ФИПС)

Бережковская наб., 30, корп. 1, Москва, Г-59, ГСП-3, 125993
Телефон (499) 240-60-15. Факс (495) 531-63-18

Москалев Евгений Андреевич
а/я 95
Москва
125009

На № от

Наш №

пат. № 2723624 (заявка № 2020100184/04)

Направляю Вам патент No 2723624 на изобретение.

Запись о регистрации патента внесена в Государственный реестр изобретений
Российской Федерации 16.06.20.

Заместитель начальника
отдела 17

Я.И. Трофимова

РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ



ПАТЕНТ

НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

№ 2723624

НАНОАМОРФНАЯ ФОРМА (RS)-3-(4-АМИНО-1-ОКСО-1,3-ДИГИДРО-2Н-ИЗОИНДОЛ-2-ИЛ)ПИПЕРИДИН-2,6-ДИОН (ВАРИАНТЫ), СПОСОБ ЕЁ ПОЛУЧЕНИЯ И ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ИММУНОЛОГИЧЕСКИХ ИЛИ ОНКОЛОГИЧЕСКИХ ЗАБОЛЕВАНИЙ

Патентообладатель: *Общество с ограниченной ответственностью «АксельФарм» (RU)*

Автор: *Торчинов Георгий Юрьевич (RU)*

Заявка № 2020100184

Приоритет изобретения 31 декабря 2019 г.

Дата государственной регистрации в

Государственном реестре изобретений

Российской Федерации 16 июня 2020 г.

Срок действия исключительного права

на изобретение истекает 31 декабря 2039 г.

*Руководитель Федеральной службы
по интеллектуальной собственности*

 Г.П. Иблиев





(51) МПК
C07D 401/04 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/445 (2006.01)
B82Y 5/00 (2011.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ**

(52) СПК

C07D 401/04 (2020.02); *A61K 31/445* (2020.02); *A61P 35/00* (2020.02); *B82Y 5/00* (2020.02).

(21)(22) Заявка: 2020100184, 31.12.2019

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
31.12.2019

Дата регистрации:
16.06.2020

Приоритет(ы):

(22) Дата подачи заявки: 31.12.2019

(45) Опубликовано: 16.06.2020 Бюл. № 17

Адрес для переписки:

125009, Москва, а/я 95, Москалев Евгений
 Андреевич

(72) Автор(ы):

Торчинов Георгий Юрьевич (RU)

(73) Патентообладатель(и):

Общество с ограниченной ответственностью
 «АксельФарм» (RU)

(56) Список документов, цитированных в отчете
 о поиске: RU 2177944 C2, 10.01.2002. WO 2009/
 114601 A2, 17.09.2009. WO 2011/034504 A1,
 24.03.2011.

(54) **НАНОАМОРФНАЯ ФОРМА (RS)-3-(4-АМИНО-1-ОКСО-1,3-ДИГИДРО-2Н-ИЗОИНДОЛ-2-ИЛ)ПИПЕРИДИН-2,6-ДИОН (ВАРИАНТЫ), СПОСОБ ЕЁ ПОЛУЧЕНИЯ И ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ИММУНОЛОГИЧЕСКИХ ИЛИ ОНКОЛОГИЧЕСКИХ ЗАБОЛЕВАНИЙ**

(57) Формула изобретения

1. Аморфная форма (RS)-3-(4-амино-1-оксо-1,3-дигидро-2H-изоиндол-2-ил)пиперидин-2,6-диона, отличающаяся тем, что она характеризуется средним размером частиц $63,85 \pm 10$ нм, температурой стеклования $122,9^\circ\text{C} \pm 7^\circ\text{C}$, кристаллизацией при температуре $172,6 \pm 5^\circ\text{C}$ с удельным тепловым эффектом $85,77 \pm 9$ Дж/г и плавлением при температуре $267,5 \pm 5^\circ\text{C}$ с удельным тепловым эффектом $149,8 \pm 15$ Дж/г в условиях дифференциальной сканирующей калориметрии при скорости нагрева $10^\circ\text{C}/\text{мин}$.

2. Способ получения аморфной формы (RS)-3-(4-амино-1-оксо-1,3-дигидро-2H-изоиндол-2-ил)пиперидин-2,6-диона по п. 1, отличающийся тем, что он включает следующие стадии:

а. загрузка (RS)-3-(4-амино-1-оксо-1,3-дигидро-2H-изоиндол-2-ил)пиперидин-2,6-диона в расплав, состоящий из 40 или 20 г D-фруктозы, 15 или 7,5 г лактозы моногидрата и 40 или 20 г мочевины при температуре 55°C ;

б. перемешивание при температуре 55°C ;

с. внесение полученного расплава в воду, охлажденную до $+7^\circ\text{C}$;

д. перемешивание;

е. фильтрация осадка;

ф. приготовление суспензии осадка в воде;

г. перемешивание при температуре 20°C в течение около 1 часа;

h. фильтрование;

i. промывание осадка водой на фильтре;

j. высушивание до постоянной массы под вакуумом при температуре +40°C.

3. Способ по п.2, отличающийся тем, что используемый на стадии а) (*RS*)-3-(4-амино-1-оксо-1,3-дигидро-2*H*-изоиндол-2-ил)пиперидин-2,6-дион получают восстановлением 3-(4-нитро-1-оксо-1,3-дигидро-2*H*-изоиндол-2-ил)пиперидин-2,6-диона серым чугуном в виде колотой дроби в 50%-ном водном этаноле в присутствии соляной кислоты.

4. Аморфная форма (*RS*)-3-(4-амино-1-оксо-1,3-дигидро-2*H*-изоиндол-2-ил)пиперидин-2,6-диона, отличающаяся тем, что она получена способом по любому из пп. 2, 3.

5. Применение аморфной формы (*RS*)-3-(4-амино-1-оксо-1,3-дигидро-2*H*-изоиндол-2-ил)пиперидин-2,6-диона по п. 1 или 4 для приготовления фармацевтической композиции для лечения иммунологических или онкологических заболеваний.

6. Фармацевтическая композиция для лечения иммунологических или онкологических заболеваний, содержащая аморфную форму по п. 1 или аморфную форму, полученную способом по любому из пп. 2, 3, в сочетании с фармацевтически приемлемыми вспомогательными веществами.

RU 2723624 C1

RU 2723624 C1