



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2009133244/04, 13.02.2008

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

13.02.2007 FR 0753211

09.03.2007 US 60/894,127

(43) Дата публикации заявки: 20.03.2011 Бюл. № 8

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 14.09.2009

(86) Заявка РСТ:

EP 2008/051755 (13.02.2008)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2008/098970 (21.08.2008)

Адрес для переписки:

191186, Санкт-Петербург, а/я 230, "АРС-
ПАТЕНТ", пат. пов. В.В.Дощечкиной

(71) Заявитель(и):

ПЬЕР ФАБР МЕДИКАМЕНТ (FR)

(72) Автор(ы):

МОРЕЛЬ Жан-Луи (FR),**ПЕНА Ришар (FR),****РИБЕ Жан-Поль (FR)****(54) БЕЗВОДНЫЕ КРИСТАЛЛИЧЕСКИЕ СОЛИ ВИНФЛУНИНА, СПОСОБ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ
И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ЛЕКАРСТВА И СПОСОБ ОЧИСТКИ ВИНФЛУНИНА****(57) Формула изобретения**

1. Безводная кристаллическая соль винфлунина, полученная с 1 или 2 эквивалентами фармацевтически приемлемой неорганической или органической кислоты.

2. Безводная кристаллическая соль винфлунина по п.1, где кристаллическое состояние установлено с помощью спектра дифракции рентгеновских лучей, демонстрирующего характеристические спектральные линии.

3. Безводная кристаллическая соль винфлунина по п.2, выбранная из fumarата, гидробромида, сульфата, лактата, пара-толуолсульфоната, бензоата, манделата и пара-гидроксibenzoата.

4. Способ получения кристаллической соли винфлунина, включающий следующие стадии:

растворение основания винфлунина в подходящем растворителе или смеси растворителей;

добавление неорганической или органической кислоты;

осаждение соли;

фильтрация и выделение образованной соли;

выдерживание и кристаллизация соли в растворителе или нерастворителе; фильтрование, промывание и сушку кристаллов в вакууме.

5. Способ по п.4, где основание винфлунина растворяют в растворителе или смеси растворителей, выбранных из ацетона, этилацетата, эфира, толуола, дихлорметана, метанола, этанола, 1-пропанола и 2-пропанола.

6. Способ по п.4, где кислота выбрана из фармацевтически приемлемых неорганических или органических кислот, таких как бромистоводородная, серная, молочная, фумаровая, пара-толуолсульфоновая, бензойная, миндальная и пара-гидроксibenзойная кислота.

7. Способ по п.4, где кислоту используют в соотношении 1 или 2 молярных эквивалента на 1 молярный эквивалент винфлунина.

8. Способ по п.4, где кислоту растворяют в воде, спирте или подходящем органическом растворителе.

9. Способ по п.4, где осаждение соли осуществляют в среде или в растворителе, или смеси растворителя и нерастворителя, таких как ацетон, этилацетат, этиловый эфир, изопропиловый эфир, толуол, гексан, гептан, циклогексан или петролейный эфир.

10. Способ по п.4, где выдерживание осуществляют в растворителе или смеси растворителя и нерастворителя, таких как ацетон, этилацетат, этиловый эфир, изопропиловый эфир, толуол, гексан, гептан, циклогексан или петролейный эфир.

11. Безводная кристаллическая соль винфлунина по любому из пп.1-3, или полученная способом по любому из пп.4-10, используемая в качестве средства для очистки винфлунина.

12. Безводная кристаллическая соль винфлунина по любому из пп.1-3, или полученная способом по любому из пп.4-10, используемая в качестве лекарства.

13. Фармацевтическая композиция, содержащая эффективное количество безводной кристаллической соли винфлунина по любому из пп.1-3, или полученной способом по любому из пп.4-10, и физиологически приемлемую среду.

14. Применение безводной кристаллической соли винфлунина по любому из пп.1-3, или полученной способом по любому из пп.4-10, для приготовления лекарства для лечения раковой патологии.