



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК
C07D 403/14 (2006.01)

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: **2009118816/04, 18.10.2007**

(30) Конвенционный приоритет:
20.10.2006 US 60/853,384

(43) Дата публикации заявки: **27.11.2010** Бюл. № 33

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: **20.05.2009**

(86) Заявка РСТ:
US 2007/022241 (18.10.2007)

(87) Публикация РСТ:
WO 2008/051440 (02.05.2008)

Адрес для переписки:
**101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", пат.пов.
И.А.Веселицкой, рег.№ 0011**

(71) Заявитель(и):
НОВАРТИС АГ (CH)

(72) Автор(ы):
**КАРПИНСКИ Пьотр (US),
МОННЬЕ Стефани (FR),
НДЗЬЕ Эльяс (CH),
ПАПОУТСАКИС Димитрис (US),
САТТОН Пол Аллен (US)**

(54) **КРИСТАЛЛИЧЕСКИЕ МОДИФИКАЦИИ 3-(1Н-ИНДОЛ-3-ИЛ)-4-[2-(4-МЕТИЛПИПЕРАЗИН-1-ИЛ)ХИНАЗОЛИН-4-ИЛ]ПИРРОЛ-2,5-ДИОНА**

(57) Формула изобретения

1. Кристаллическая форма ацетата 3-(1Н-индол-3-ил)-4-[2-(4-метилпиперазин-1-ил)хиназолин-4-ил]пиррол-2,5-диона.

2. Кристаллическая форма по п.1, являющаяся безводной.

3. Кристаллическая форма по п.1 или 2, представляющая собой форму А, форму В, форму S_A или их смесь.

4. Кристаллическая форма по п.1 или 2, имеющая сильный дифракционный пик при угле 2θ, составляющем 9,7°.

5. Кристаллическая форма по п.1 или 2, имеющая сильный дифракционный пик при угле 2θ, составляющем 21,5°.

6. Кристаллическая форма по п.1, представляющая собой сольват или гидрат.

7. Кристаллическая форма по п.1 или 2, обладающая высокой кристаллическостью.

8. Кристаллическая форма по п.1 или 2, по существу, в чистой форме.

9. Применение кристаллической формы по одному из пп.1-8 или их смеси для получения фармакологического агента для предотвращения или лечения заболеваний или расстройств, опосредованных Т-лимфоцитами и/или РКС, таких как острое или хроническое отторжение органов, тканей, алло- или ксенотрансплантанов, или опосредованных Т-клетками воспалительных или аутоиммунных заболеваний.

10. Способ получения кристаллической формы по одному из пп.1-8, включающий образование раствора ацетата 3-(1Н-индол-3-ил)-4-[2-(4-метилпиперазин-1-ил)хиназолин-4-ил]пиррол-2,5-диона и кристаллизацию ацетата из раствора посредством осаждения или перекристаллизации.

RU 2009118816 A

RU 2009118816 A