



(51) МПК
C07D 417/12 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61K 31/10 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 31/4402 (2006.01)
A61P 31/22 (2006.01)

(12) ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21)(22) Заявка: 2014116621, 26.09.2012

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
26.09.2012Дата регистрации:
16.12.2016

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
26.09.2011 EP 11007803.7

(43) Дата публикации заявки: 10.11.2015 Бюл. № 31

(45) Опубликовано: 10.01.2017 Бюл. № 1

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 28.04.2014(86) Заявка РСТ:
EP 2012/068958 (26.09.2012)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2013/045491 (04.04.2013)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(72) Автор(ы):

ШВАБ Вильфрид (DE),
БИРКМАНН Александр (DE),
ПАУЛУС Керстин (DE),
ФЕГТЛИ Курт (CH),
ХААГ Дитер (CH),
МААС Штефан (DE),
РУЭПП Кристиан (DE)

(73) Патентообладатель(и):

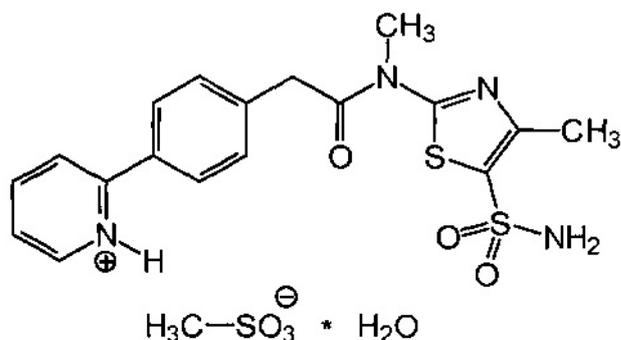
АЙКУРИС ГМБХ УНД КО. КГ (DE)

(56) Список документов, цитированных в отчете
о поиске: US 20080220059 A1, 11.09.2008. WO
01/47904 A1, 05.07.2001. Betz UA et al. "Potent
in vivo antiviral activity of the herpes simplex
virus primase-helicase inhibitor BAY 57-1293"
Antimicrob Agents Chemother., 2002, 46(6), p.
1766-1772. EA 1339 B1, 26.02.2001.

(54) **МОНОГИДРАТ МЕЗИЛАТА N-[5-(АМИНОСУЛЬФОНИЛ)-4-МЕТИЛ-1,3-ТИАЗОЛ-2-ИЛ]-N-МЕТИЛ-2-[4-(2-ПИРИДИНИЛ)ФЕНИЛ]АЦЕТАМИДА, ОБЛАДАЮЩИЙ ОПРЕДЕЛЕННЫМ ДИАПАЗОНОМ РАСПРЕДЕЛЕНИЯ ЧАСТИЦ ПО РАЗМЕРАМ И УДЕЛЬНОЙ ПЛОЩАДИ ПОВЕРХНОСТИ, ДЛЯ ИСПОЛЬЗОВАНИЯ В ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИХ ПРЕПАРАТАХ**

(57) Формула изобретения

1. Кристаллический моногидрат N-[5-(аминоссульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты следующей формулы



где частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты имеют размер частиц в интервале от 1 до 500 мкм, распределение частиц по размерам, которое определяется в $d(0,1)$ от 2 до 100 мкм, $d(0,5)$ от 30 до 210 мкм и $d(0,9)$ от 70 до 400 мкм, и удельную площадь поверхности менее чем $1,0 \text{ м}^2/\text{г}$.

2. Кристаллический моногидрат N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты по п. 1, где частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты имеют размер частиц в интервале от 2 мкм до 400 мкм.

3. Кристаллический моногидрат N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты по п. 1, где частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты имеют распределение частиц по размерам, которое определяется в $d(0,1)$ от 10 до 75 мкм, $d(0,5)$ от 100 до 175 мкм, $d(0,9)$ от 200 до 350 мкм.

4. Кристаллический моногидрат N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты по п. 1, где частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты характеризуются удельной площадью поверхности менее чем $0,3 \text{ м}^2/\text{г}$.

5. Кристаллический моногидрат N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты по любому из пп. 1-4 для применения при лечении и/или профилактике инфекционных заболеваний и/или профилактике передачи инфекционного заболевания.

6. Кристаллический моногидрат N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты по п. 5, где инфекционным заболеванием является инфекция, вызванная вирусами простого герпеса.

7. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики инфекционных заболеваний, содержащая кристаллические частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты, где частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты имеют размер частиц в интервале от 1 до 500 мкм, распределение частиц по размерам, которое определяется в $d(0,1)$ от 2 до 100 мкм, $d(0,5)$ от 30 до 210 мкм и $d(0,9)$ от 70 до 400 мкм, и удельную площадь поверхности менее чем $1,0 \text{ м}^2/\text{г}$, вместе по меньшей мере с одним фармацевтически приемлемым носителем, инертным наполнителем, растворителем и/или разбавителем.

8. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики инфекционных

заболеваний по п. 7, где частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты имеют размер частиц в интервале от 2 мкм до 400 мкм.

9. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики инфекционных заболеваний по п. 7, где частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты имеют распределение частиц по размерам, которое определяется в $d(0,1)$ от 10 до 75 мкм, $d(0,5)$ от 100 до 175 мкм, $d(0,9)$ от 200 до 350 мкм.

10. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики инфекционных заболеваний по п. 7, где частицы моногидрата N-[5-(аминосульфонил)-4-метил-1,3-тиазол-2-ил]-N-метил-2-[4-(2-пиридинил)фенил]ацетамида монометансульфоновой кислоты характеризуются удельной площадью поверхности менее чем $0,3 \text{ м}^2/\text{г}$.

11. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики инфекционных заболеваний по любому одному из пп. 7-10 для профилактики передачи инфекционного заболевания.

12. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики инфекционных заболеваний по п. 11, где инфекционным заболеванием является инфекция вируса простого герпеса.

13. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики инфекционных заболеваний по п. 11, где фармацевтическую композицию следует вводить три раза в день, два раза в день, один раз в день, три раза в неделю, два раза в неделю или один раз в неделю.

RU 2606628 C2

RU 2606628 C2