ROYAUME DU MAROC

OFFICE MAROCAIN DE LA PROPRIETE INDUSTRIELLE ET COMMERCIALE
---

(19)

المملكة المغربية
المكتب المغربي للملكية الصناعية و التجارية

(12) BREVET D'INVENTION

(11) N° de publication :
MA 43833 B1

(51) Cl. internationale :
C07D 207/48; A61K 31/40

(43) Date de publication :
31.08.2020

(21) N° Dépôt :
43833

(22) Date de Dépôt :
17.03.2017

(30) Données de Priorité :
25.03.2016 KR 20160036080

(86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:
PCT/KR2017/002914 17.03.2017

(86) N° de dépot auprès de l'organisme de validation:EP17770546.4

(71) Demandeur(s) :
Daewoong Pharmaceutical Co., Ltd., 35-14, Jeyakgongdan 4-gil, Hyangnam-eup Hwaseong-si Gyenoggi-do 18623 (KR)

(72) Inventeur(s) :
KIM, Aeri ; CHO, Kwan Hyung

(74) Mandataire :
U.T.P.S.CO.LTD

(54) Titre : **NOUVELLE FORME CRISTALLINE DE SEL DE 1-(5-(2,4-DIFLUOROPHÉNYL)-1-((3-FLUOROPHÉNYL)SULFONYL)-4-MÉTHOXY-1H-PYRROL-3-YL)-N-MÉTHYLMÉTHANAMINE**

(57) Abrégé : La présente invention décrit une nouvelle forme cristalline I de chlorhydrate, une forme cristalline II de chlorhydrate, une forme cristalline de succinate, une forme cristalline de tartrate, une forme cristalline I de fumarate et une forme cristalline II de fumarate de 1-(5-(2,4-difluorophényl)-1-((3-fluorophényl)sulfonyl)-4-méthoxy-1H-pyrrol-3-yl)-N-méthylméthanamine. Les nouvelles formes cristallines ci-dessus décrites présentent une solubilité élevée dans l'eau et une excellente stabilité sous des conditions de résistance à l'humidité et des conditions d'exposition à une humidité élevée, et peuvent donc être pharmaceutiquement employées.

عناصر الحماية

1- صورة بلورية I من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل) -4- ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين هيدروكلوريد بها قمم عند زوايا حيود (2θ ± 0.2°) من 5.8°، 9.7°، 10.0°، 12.8°، 13.2°، 17.4° و 18.5° في نمط حيود مسحوق الأشعة السينية.

2- صورة بلورية I من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل) -4- ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين هيدروكلوريد لعنصر الحماية 1،

حيث أن الصورة البلورية I لها درجة حرارة بدء امتصاص الحرارة 215.02±3°م وتظهر أقصى قمة امتصاص الحرارة عند درجة حرارة امتصاص الحرارة 217.11±3°م في تحليل مسعر المسح التباييني أو التفاضلي.

3- صورة بلورية II من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل) -4- ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين هيدروكلوريد بها قمم عند زوايا حيود (2θ ± 0.2°) من 9.2°، 10.0°، 12.9°، و 20.2° في نمط حيود مسحوق الأشعة السينية.

4- صورة بلورية II من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل)-4- ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين هيدروكلوريد لعنصر الحماية 3،

حيث أن الصورة البلورية II لها درجة حرارة بدء امتصاص الحرارة 213.14±3°م وتظهر أقصى قمة امتصاص الحرارة عند درجة حرارة امتصاص الحرارة 215.7±3°م في تحليل مسعر المسح التباييني أو التفاضلي.

5- صورة بلورية من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل) -4-ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين سكسينات بها قمم عند زوايا حيود (2θ ± 0.2°) من 8.0°، 11.2°، 12.0°، 14.9°، 22.1° و 24.1° في نمط حيود مسحوق الأشعة السينية.

6- صورة بلورية من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل)-4-ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين سكسينات لعنصر الحماية 5،

حيث أن الصورة البلورية لها درجة حرارة بدء امتصاص الحرارة 132.3±3°م وتظهر أقصى قمة امتصاص الحرارة عند درجة حرارة امتصاص الحرارة من 133.9±3°م في تحليل مسعر المسح التباييني أو التفاضلي.

7- صورة بلورية من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل) -4-ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين طرطرات بها قمم عند زوايا حيود (2θ ± 0.2°) من 11.7°، 21.5°، و23.5° في نمط حيود مسحوق الأشعة السينية.

8- صورة بلورية من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل)-4-ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين طرطرات لعنصر الحماية 7،

حيث أن الصورة البلورية لها درجة حرارة بدء امتصاص الحرارة 146.34±3°م وتظهر أقصى قمة امتصاص الحرارة عند درجة حرارة امتصاص الحرارة 148.27±3°م في تحليل مسعر المسح التباييني أو التفاضلي.

9- صورة بلورية I من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل) -4-ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين فيومارات بها قمم عند زوايا حيود (2θ ± 0.2°) من 7.9°، 11.9° و 24.0° في نمط حيود مسحوق الأشعة السينية.

10- صورة بلورية I من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل) -4-ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين فيومارات لعنصر الحماية 9،

حيث أن الصورة البلورية I لها درجة حرارة بدء امتصاص الحرارة 164.97±3°م وتظهر أقصى قمة امتصاص الحرارة عند درجة حرارة امتصاص الحرارة من 167.46±3°م في تحليل مسعر المسح التباييني أو التفاضلي.

11- صورة بلورية II من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل) -4-ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين فيومارات بها قمم عند زوايا حيود (2θ ± 0.2°) من 8.4°، 10.5°، و 19.02° في نمط حيود مسحوق الأشعة السينية.

12- صورة بلورية II من 1-(5-(2، 4- ثاني فلورو فنيل)-1-((3-فلورو فنيل) سلفونيل)-4-ميثوكسي-1H- بيرول-3-يل)-N- مثيل ميثان أمين فيومارات لعنصر الحماية 11،

حيث أن الصورة البلورية II لها درجة حرارة بدء امتصاص الحرارة من 179.47±3°م وتظهر أقصى قمة امتصاص الحرارة عند درجة حرارة امتصاص الحرارة من 189.05±3°م في تحليل مسعر المسح التباييني أو التفاضلي.