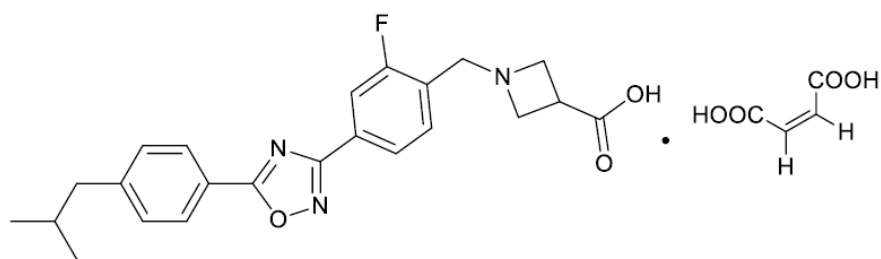


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения возражения заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 1 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 231-ФЗ, в редакции действующей на дату подачи возражения и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденными приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020 г. № 644/261, зарегистрированными в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454, с изменениями, внесенными приказом Минобрнауки России и Минэкономразвития России от 23.11.2022 № 1140/646 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение СУЧЖОУ КОННЕКТ БАЙОФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ЛТД., Китай (далее – заявитель), поступившее 01.11.2023, на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее Роспатент) от 04.04.2023 об отказе в выдаче патента Российской Федерации на изобретение по заявке № 2020139021, при этом установлено следующее.

Заявлено изобретение «СОЛЬ ПРИСОЕДИНЕНИЯ АГОНИСТА РЕЦЕПТОРА S1P1 И ЕЕ КРИСТАЛЛИЧЕСКАЯ ФОРМА И ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ НА ЕЕ ОСНОВЕ», охарактеризованное в формуле изобретения, представленной в корреспонденции от 14.02.2023, в следующей редакции:

«1. Малеат соединения, представленного формулой А, имеющий структуру, представленную следующей формулой:



I,

где малеат представляет собой кристаллическую форму и при облучении Си-К α -излучением кристаллическая форма характеризуется порошковой рентгеновской дифрактограммой с характеристическими пиками при следующих значениях угла 2θ со следующими относительными значениями интенсивности:

| 2θ | Относительное значение интенсивности, % |
|----------------------|---|
| $5,3 \pm 0,2^\circ$ | 3,4 |
| $7,0 \pm 0,2^\circ$ | 5,8 |
| $10,6 \pm 0,2^\circ$ | 100 |
| $13,6 \pm 0,2^\circ$ | 6,6 |
| $14,5 \pm 0,2^\circ$ | 3,2 |
| $16,3 \pm 0,2^\circ$ | 12,2 |
| $19,5 \pm 0,2^\circ$ | 37,7 |
| $20,1 \pm 0,2^\circ$ | 8,6 |
| $20,7 \pm 0,2^\circ$ | 2,8 |
| $21,5 \pm 0,2^\circ$ | 18,3 |
| $24,5 \pm 0,2^\circ$ | 11,4 |
| $24,7 \pm 0,2^\circ$ | 9,6 |
| $25,3 \pm 0,2^\circ$ | 1,8 |
| $26,1 \pm 0,2^\circ$ | 1,9 |
| $26,9 \pm 0,2^\circ$ | 34,5 |
| $28,7 \pm 0,2^\circ$ | 2,2 |

2. Малеат по п.1, где кристаллическая форма характеризуется порошковой рентгеновской дифрактограммой, показанной на фиг. 10.

3. Малеат по п.1 или п. 2, где кристаллическая форма характеризуется инфракрасным спектром, полученным с использованием преобразования Фурье, имеющим характеристические пики при длинах волн 1734см^{-1} , 1574см^{-1} , 1485см^{-1} , 1439см^{-1} , 1364см^{-1} , 1346см^{-1} , 1080см^{-1} , 1003см^{-1} , 893см^{-1} , 871см^{-1} , 757см^{-1} и 729см^{-1} .

4. Способ получения малеата по любому из пп. 1-3 , включающий следующие стадии:

получение суспензии или раствора соединения, представленного формулой А, и суспензии или раствора малеиновой кислоты в растворителе, выбранном из группы, состоящей из этанола, ацетона, диэтилового эфира, воды, этилацетата, 1,4 диоксана или их смеси соответственно; смешивание суспензии или раствора соединения, представленного формулой А, и малеиновой кислоты в молярном соотношении 1:1,0-1:2,6 для осуществления реакции, при этом реакцию проводят при 10-40 °С при перемешивании в течение 10-24 ч.; удаление растворителя после завершения реакции; и выполнение высушивания при 10-40 °С в течение 1-24 ч.;

и при этом отношение массы соединения, представленного формулой А, к объему растворителя в данном способе составляет 4 мг:1 мл-26 мг:1 мл;

5. Фармацевтическая композиция для лечения и/или предупреждения заболевания или состояния, опосредованных рецептором S1P1, содержащая терапевтически и/или профилактически эффективное количество малеата по любому из пп. 1-3 и необязательно по меньшей мере один фармацевтически приемлемый носитель или вспомогательное вещество.

6. Применение малеата по любому из пп. 1-3 при изготовлении лекарственного препарата для лечения и/или предупреждения заболевания или состояния, опосредованных рецептором S1P1 , где заболевание или состояние , опосредованное рецептором S1P1, выбрано из группы, состоящей из ревматоидного артрита, рассеянного склероза, воспалительного энтерита, аутоиммунных заболеваний, хронических воспалительных заболеваний, астмы, воспалительной невропатии, артрита, трансплантации, болезни Крона , язвенного колита, красной волчанки, псориаза, ишемически-реперфузионного повреждения, солидных опухолей, связанных с ангиогенезом заболеваний, сосудистых заболеваний, болевых симптомов, острых вирусных заболеваний, воспалительных заболеваний кишечника, инсулинозависимого и инсулинонезависимого сахарного диабета и других родственных иммунопатологических заболеваний.

7. Применение по п. 6, где заболевание или состояние, опосредованное рецептором S1P1 выбрано из группы, состоящей из рассеянного склероза, ревматоидного артрита, воспалительного энтерита и псориаза.

8. Применение малеата по п. 1 при изготовлении лекарственного препарата для лечения болезни Крона или язвенного колита.

9. Применение фармацевтической композиции по п. 5 при изготовлении лекарственного препарата для лечения болезни Крона или язвенного колита.

10. Способ лечения и/или предупреждения заболевания или состояния, опосредованных рецептором S1P1, включающий введение субъекту, нуждающемуся в этом, малеата по любому из пп. 1-3 или фармацевтической композиции по п. 5, где заболевание или состояние, опосредованное рецептором S1P1, выбрано из группы, состоящей из ревматоидного артрита, рассеянного склероза, воспалительного энтерита, аутоиммунных заболеваний, хронических воспалительных заболеваний, астмы, воспалительной невропатии, артрита, трансплантации, болезни Крона, язвенного колита, красной волчанки, псориаза, ишемически-реперфузионного повреждения, солидных опухолей, связанных с ангиогенезом заболеваний, сосудистых заболеваний, болевых симптомов, острых вирусных заболеваний, воспалительных заболеваний кишечника, инсулинозависимого и инсулинонезависимого сахарного диабета и других родственных иммунопатологических заболеваний.

11. Способ по п. 10, где заболевание или состояние, опосредованное рецептором S1P1 выбрано из группы, состоящей из рассеянного склероза, ревматоидного артрита, воспалительного энтерита и псориаза.

12. Способ по п. 10 или п. 11, где субъект представляет собой млекопитающее.

13. Способ по любому из пп. 10 - 12, где субъект представляет собой человека.

14. Способ лечения болезни Крона или язвенного колита, включающий введение субъекту, нуждающемуся в этом, малеата по п. 1.

15. Способ по п. 14, где субъект представляет собой млекопитающее.

16. Способ по п. 14 или п. 15, где субъект представляет собой человека.

17. Способ лечения болезни Крона или язвенного колита, включающий введение субъекту, нуждающемуся в этом, фармацевтической композиции по п. 5.

18. Способ по п. 17, где субъект представляет собой млекопитающее.

19. Способ по п. 17 или п. 18, где субъект представляет собой человека.

По результатам проведения экспертизы по существу Роспатентом было принято решение об отказе в выдаче патента на изобретение ввиду несоответствия предложенного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В подтверждение данного мнения в решении указаны следующие источники информации:

- патентный документ EP 3048103 A1, дата публикации 27.07.2016 (ссылка Д1) (далее - [1]);

- патентный документ CN 105315266 A, дата публикации 10.02.2016 (ссылка Д2) (далее - [2]);

- статья Richard J. Bastin et al.: "Salt selection and Optimisation Procedures for Pharmaceutical New Chemical Entities", ORGANIC PROCESS RESEARCH & DEVELOPMENT, 2000, vol.4, p.427-435 (DOI: 10.1021/op000018u) (ссылка Д6) (далее – [3]);

- статья MINO R. CAIRA: "Crystalline Polymorphism of Organic Compounds", TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY, 1998, vol.198, pp.163-208 (стр.164, section 3.1) (ссылка Д5) (далее – [4]);

- статья Sherry L.Morissette et al.: "High-throughput crystallization: polymorphs, salts, co-crystals and solvates of pharmaceutical solids", ADVANCED DRUG DELIVERY REVIEWS, 2004, v.56, pp.275-300 (section1, 3.1) (DOI:10.1016/J.ADDR.2003.10.020) (ссылка Д7) (далее – [5]);

- патентный документ WO 2003/105771 A2, дата публикации 24.12.2003 (ссылка Д8) (далее – [6]).

Доводы, изложенные в решении Роспатента основаны на том, что из патентного документа [1], являющегося ближайшим аналогом предложенного изобретения, известно соединение 1-(2-фтор-4-(5-(4-изобутилфенил)1,2,4-

оксадиазол-3-ил)бензил-3-азетидинкарбоновая кислота, в том числе в кристаллической форме, которое может применяться для лечения ряда заболеваний, опосредованных активностью рецептора S1P1 и в составе фармацевтических композиций.

Патентный документ [1] не раскрывает получение малеата известного соединения и соответственно его кристаллическую форму, охарактеризованную определенными характеристическими пиками порошковой рентгенограммы. Соответственно, данные признаки являются отличиями изобретений по независимым пунктам 1, 5, 6, 8, 9, 10, 14 и 17 формулы от известного из патентного документа [1] технического решения.

В решении Роспатента отмечено, что технический результат предложенной группы изобретений, исходя из описания, заключается в получении конкретной соли малеата соединения А, в кристаллической форме, предназначенной для лечения заболеваний, опосредованных S1P1, при этом малеат соединения А обладает улучшенной стабильностью, растворимостью, гигроскопичностью и растворимостью.

Вместе с тем в решении Роспатента раскрыто, что из патентного документа [2] известно о получении 1-(2-фтор-4-(5-(4-изобутилфенил)1,2,4-оксадиазол-3-ил)бензил-3-азетидинкарбоновой кислоты в различных кристаллических модификациях.

При этом из источников информации [2]-[6], известно, что получение солевых форм соединений, включая их кристаллические формы, осуществляется именно по причине модифицирования физико-химических характеристик, таких как стабильность, чистота, растворимость, гигроскопичность и т.д.

Таким образом, в решении Роспатента сделан вывод о том, что, несмотря на отсутствие в уровне техники сведений о получении конкретной соли известного соединения с указанными характеристиками, получение новой формы с достижением такого технического результата как улучшенная

стабильность, гигроскопичность и растворимость явным образом следует из уровня техники.

В отношении способа получения малеата соединения А по независимому пункту 4 формулы в решении Роспатента сделан вывод о том, что он может быть признан соответствующим условию патентоспособности изобретательский уровень, поскольку явным образом не следует из известного уровня техники.

На решение об отказе в выдаче патента на изобретение в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 упомянутого выше Гражданского Кодекса Российской Федерации поступило возражение, суть доводов которого сводится к следующему.

С целью получения правовой охраны на объект изобретения «способ получения малеата соединения А», признанный в решении Роспатента патентоспособным, заявитель просит принять к рассмотрению измененную формулу изобретения, в которую внесены следующие уточнения:

- пункты 1-3 и 5-19 из формулы изобретения исключены;
- независимый пункт 4 формулы перенумерован в пункт 1 формулы и отсылки в нем уточнены на основании признаков пункта 1 предыдущей редакции формулы;
- на основании пунктов 1-3 предыдущей редакции формулы, включены в формулу изобретения новые зависимые пункты 2-4 формулы.

Уточнённая формула изобретения к возражению приложена.

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, коллегия установила следующее.

С учетом даты подачи заявки (04.05.2018) правовая база для оценки патентоспособности включает упомянутый выше Гражданский Кодекс Российской Федерации в редакции, действовавшей на дату подачи заявки (далее – Кодекс), Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации изобретений, и их формы (далее – Правила ИЗ),

утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 № 42800, Требования к документам заявки на выдачу патента на изобретение (далее – Требования ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 № 42800.

Согласно пункту 1 статьи 1350 Кодекса изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно пункту 2 статьи 1350 Кодекса изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники.

Изобретение имеет изобретательский уровень, если для специалиста оно явным образом не следует из уровня техники.

Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Согласно пункту 2 статьи 1378 Кодекса дополнительные материалы изменяют заявку на изобретение по существу в одном из следующих случаев, если они содержат:

иное изобретение, не удовлетворяющее требованию единства изобретения в отношении изобретения или группы изобретений, принятых к рассмотрению, либо иную полезную модель;

признаки, которые подлежат включению в формулу изобретения и не были раскрыты в документах заявки, представленных на дату подачи заявки;

указание на технический результат, который обеспечивается изобретением и не связан с техническим результатом, содержащимся в тех же документах.

Согласно пункту 1 статьи 1387 Кодекса если в процессе экспертизы заявки на изобретение по существу установлено, что заявленное изобретение, выраженное формулой, предложенной заявителем, не соответствует условиям патентоспособности, предусмотренным статьей 1350 настоящего Кодекса,

Федеральный орган исполнительной власти по интеллектуальной собственности принимает решение об отказе в выдаче патента.

Согласно пункту 72 Правил ИЗ если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, соответствует условию новизны, осуществляется проверка изобретательского уровня изобретения. Проверка новизны зависимых пунктов не проводится.

Согласно пункту 75 Правил ИЗ, при проверке изобретательского уровня изобретение признается имеющим изобретательский уровень, если установлено, что оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Согласно пункту 76 Правил ИЗ проверка изобретательского уровня изобретения может быть выполнена по следующей схеме:

- определение наиболее близкого аналога изобретения;
- выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);
- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками заявленного изобретения;
- анализ уровня техники в целях подтверждения известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 77 Правил ИЗ, не признается соответствующим условию изобретательского уровня изобретение, основанное на выборе оптимальных или рабочих значений параметров, если подтверждена известность влияния этих параметров на технический результат, а выбор может быть осуществлен обычным методом проб и ошибок или применением обычных технологических методов или методов конструирования.

Согласно пункту 82 Правил ИЗ если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, соответствует условию изобретательского уровня, проверка изобретательского уровня в отношении

зависимых пунктов формулы не проводится.

Согласно пункту 35 Требований ИЗ в качестве аналога изобретения указывается средство, имеющее назначение, совпадающее с назначением изобретения, известное из сведений, ставших общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Согласно пункту 52 Требований ИЗ формула изобретения предназначается для определения объема правовой охраны изобретения, предоставляемой на основании патента.

Согласно пункту 39 Правил ППС в рамках рассмотрения возражения лицо, подавшее возражение, вправе ходатайствовать об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, при условии, если испрашиваемые изменения могут устранить причины, препятствующие предоставлению правовой охраны заявленному объекту, либо в случае, если без внесения соответствующих изменений в предоставлении правовой охраны должно быть отказано в полном объеме, а при их внесении – частично.

Существо заявленного изобретения выражено в приведенной выше формуле.

Анализ доводов, содержащихся в возражении и решении Роспатента, с учетом материалов заявки, касающихся оценки соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Следует согласиться с доводом, изложенным в решении Роспатента о том, что наиболее близким аналогом к предложенному изобретению является, техническое решение, раскрытое в патентном документе [1].

Так, из патентного документа [1] известно соединение 1-(2-фтор-4-(5-(4-изобутилфенил)1,2,4-оксадиазол-3-ил)бензил-3-азетидинкарбоновая кислота (соединение А), в том числе в кристаллической форме (см. примеры 2,12-21, пп.1-4 формулы), которое может применяться для лечения ряда заболеваний, опосредованных активностью рецептора S1P1 и в составе фармацевтических композиций (с.4 параграфы 0016-0017, с.5 параграфы 0018- 0025, примеры 6-

11, пункты 1-10 формулы).

Соответственно, отличительными признаками изобретений, охарактеризованных в пунктах 1, 5, 6, 8, 9, 10, 14 и 17 формулы от известного из патентного документа [1] технического решения является признаки характеризующие конкретную соль (малеат) и параметры кристаллической решетки.

Технический результат предложенной группы изобретений, согласно описанию, заключается в получении конкретной соли малеата соединения А, в кристаллической форме, предназначенной для лечения заболеваний, опосредованных S1P1, при этом малеат соединения А характеризуется улучшенной стабильностью, растворимостью, гигроскопичностью и растворимостью (см. сравнительные примеры 3-6).

Однако из патентного документа [2] известно о получении 1-(2-фтор-4-(5-(4-изобутилфенил)1,2,4-оксадиазол-3-ил) бензил-3-азетидинкарбоновой кислоты в различных кристаллических модификациях (примеры, формула изобретения).

При этом следует согласиться с доводами, изложенными в решении Роспатента о том, что из источников информации [2]-[6], известно, что получение солевых форм соединений, включая их кристаллические формы, осуществляется именно по причине модифицирования физико-химических характеристик, таких как стабильность, чистота, растворимость, гигроскопичность и т.д.

Также следует согласиться с выводом, сделанным в решении Роспатента, что получение новой формы соединения А с достижением такого технического результата как улучшенная стабильность, гигроскопичность и растворимость явным образом следует из уровня техники (см. пункт 77 Правил).

Таким образом, следует констатировать, что с учетом сведений, раскрытых в источниках информации [1]-[4] получение твердых солевых модификаций известного соединения можно осуществить методом подбора

условий для способа получения, то есть путем проб и ошибок.

Соответственно, решение Роспатента принято правомерно (подпункт 1 пункта 1387 Кодекса, изобретения охарактеризованные в пунктах 1, 5, 6, 8, 9, 10, 14 и 17 формулы не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

В соответствии с пунктом 39 Правил ППС заявитель воспользовался своим правом и представил уточненную формулу изобретения, содержащую притязания только в отношении объекта «способ получения малеата соединения А», поскольку в отношении упомянутого способа (ранее независимый пункт 4 формулы) в решении Роспатента сделан вывод о том, что он может быть признан соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В уточненную формулу, как изложены выше в настоящем заключении, были внесены признаки из независимого пункта 1 и включены новые зависимые пункты 2-4 (на основании первоначальных пунктов 1-3 формулы).

Уточненная заявителем формула изобретения не изменяет заявку по существу (пункт 2 статьи 1378 Кодекса). При этом не выявлено препятствий для направления на проведение дополнительного информационного поиска в отношении формулы изобретения, представленной заявителем с возражением.

При проведении дополнительного информационного поиска новых источников информации, раскрывающих способ получения малеата соединения А, в том числе, в кристаллической форме, не выявлено. При составлении заключения во внимание приняты источники информации [1]-[6].

В заключении указано, что из источников информации [1]-[6] не известен способ получения малеата 1-{2-фтор-4-[5-(4-изобутилфенил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензил}-3-азетидинкарбоновой кислоты, в том числе, в кристаллической форме. Соответственно, предложенное изобретение по пунктам 1-4 уточненной формулы соответствует условию патентоспособности «новизна» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Что касается соответствия предложенного изобретения условию

патентоспособности «изобретательский уровень», то наиболее близким аналогом заявленного изобретения является патентный документ [1], раскрывающий способ получения 1-{2-фтор-4-[5-(4-изобутилфенил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил] бензил}-3-азетидинкарбоновой кислоты.

Предложенный в уточненной формуле способ получения отличается от известного тем, что относится к способу получения малеата 1-{2-фтор-4-[5-(4-изобутилфенил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил] бензил}-3-азетидинкарбоновой кислоты, который осуществляют при соблюдении соответствующих условий, а именно растворители, температура и соотношение.

Из статьи [3] известно, что получение солевых форм агонистов S1P1 осуществляют путем взаимодействия основания с кислотой в присутствии растворителя.

Однако техническая задача, решаемая настоящим изобретением, заключается в получении конкретной соли малеата соединения А и его кристаллической форме, предназначенных для лечения заболеваний, опосредованных S1P1, при этом малеат соединения А обладает улучшенной стабильностью, растворимостью, гигроскопичностью и растворимостью (см. описание изобретения и сравнительные примеры 3-6).

Из уровня техники, а именно патентного документа [1] и статьи [3] не известно получение малеата 1-{2-фтор-4-[5-(4-изобутилфенил)-1,2,4-оксадиазол-3-ил]бензил}-3-азетидинкарбоновой кислоты, в заявленной совокупности признаков способа. Соответственно, способ по независимому пункту 1 соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Таким образом, необходимо констатировать, что не выявлено препятствий для выдачи патента Российской Федерации на изобретение, охарактеризованное в представленной с возражением, уточненной формуле изобретения.

Учитывая вышеизложенное, коллегия пришла к выводу о наличии оснований для принятия Роспатентом следующего решения:

удовлетворить возражение, поступившее 01.11.2023, отменить решение Роспатента от 04.04.2023 и выдать патент Российской Федерации на изобретение с формулой, представленной с возражением.

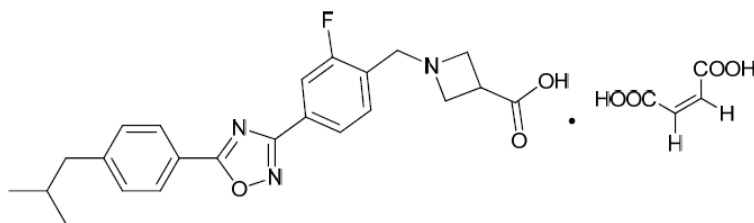
(21) 2020139021

(51) МПК

C07D 413/10 (2006.01)**A61K 31/4245** (2006.01)**A61P 37/06** (2006.01)

(57)

1. Способ получения малеата, имеющего структуру, представленную формулой I:

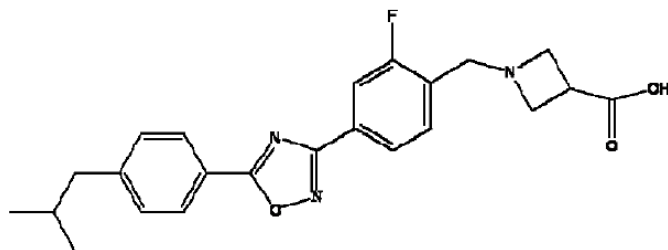


I,

включающий следующие стадии:

получение суспензии или раствора соединения, представленного формулой А, и суспензии или раствора малеиновой кислоты в растворителе, выбранном из группы, состоящей из этанола, ацетона, диэтилового эфира, воды, этилацетата, 1,4 диоксана или их смеси соответственно; смешивание суспензии или раствора соединения, представленного формулой А, и малеиновой кислоты в молярном соотношении 1:1,0-1:2,6 для осуществления реакции, при этом реакцию проводят при 10-40 °С при перемешивании в течение 10-24 ч.; удаление растворителя после завершения реакции; и выполнение высушивания при 10-40 °С в течение 1-24 ч.;

и при этом отношение массы соединения, представленного формулой А, к объему растворителя в данном способе составляет 4 мг:1 мл-26 мг:1 мл;



А.

2. Способ по п. 1, где малеат представляет собой кристаллическую форму, и при облучении $\text{Cu-K}\alpha$ -излучением кристаллическая форма характеризуется порошковой рентгеновской дифрактограммой с характеристическими пиками при следующих значениях угла 2θ со следующими относительными значениями интенсивности:

| 2θ | Относительное значение интенсивности, % |
|----------------------|---|
| $5,3 \pm 0,2^\circ$ | 3,4 |
| $7,0 \pm 0,2^\circ$ | 5,8 |
| $10,6 \pm 0,2^\circ$ | 100 |
| $13,6 \pm 0,2^\circ$ | 6,6 |
| $14,5 \pm 0,2^\circ$ | 3,2 |
| $16,3 \pm 0,2^\circ$ | 12,2 |
| $19,5 \pm 0,2^\circ$ | 37,7 |
| $20,1 \pm 0,2^\circ$ | 8,6 |
| $20,7 \pm 0,2^\circ$ | 2,8 |
| $21,5 \pm 0,2^\circ$ | 18,3 |
| $24,5 \pm 0,2^\circ$ | 11,4 |
| $24,7 \pm 0,2^\circ$ | 9,6 |
| $25,3 \pm 0,2^\circ$ | 1,8 |
| $26,1 \pm 0,2^\circ$ | 1,9 |
| $26,9 \pm 0,2^\circ$ | 34,5 |
| $28,7 \pm 0,2^\circ$ | 2,2 |

3. Способ по п. 2, где кристаллическая форма характеризуется порошковой рентгеновской дифрактограммой, показанной на фиг. 10.

4. Способ по п. 2 или п. 3, где кристаллическая форма характеризуется инфракрасным спектром, полученным с использованием преобразования Фурье, имеющим характеристические пики при длинах волн 1734 см^{-1} , 1574 см^{-1} , 1485 см^{-1} , 1439 см^{-1} , 1364 см^{-1} , 1346 см^{-1} , 1080 см^{-1} , 1003 см^{-1} , 893 см^{-1} , 871 см^{-1} , 757 см^{-1} и 729 см^{-1} .

(56)

EP 3048103 A1, 27.07.2016;

CN 105315266 A, 10.02.2016;

Richard J. Bastin et al.: "Salt selection and Optimisation Procedures for Pharmaceutical New Chemical Entities", ORGANIC PROCESS RESEARCH & DEVELOPMENT, 2000, vol.4, p.427-435 (DOI: 10.1021/op000018u);

MINO R. CAIRA: "Crystalline Polymorphism of Organic Compounds", TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY, 1998, vol.198, pp.163-208;

Sherry L.Morissette et al.: "High-throughput crystallization: polymorphs, salts, co-crystals and solvates of pharmaceutical solids", ADVANCED DRUG DELIVERY REVIEWS, 2004, v.56, pp.275-300 (DOI:10.1016/J.ADDR.2003.10.020);

WO 2003/105771 A2, 24.12.2003.

В соответствии с уточненной формулой изобретения, название изобретения уточнено следующим образом: «СОЛЬ ПРИСОЕДИНЕНИЯ АГОНИСТА РЕЦЕПТОРА S1P, ЕЕ КРИСТАЛЛИЧЕСКАЯ ФОРМА И СПОСОБ ЕЕ ПОЛУЧЕНИЯ».