

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国际局



(10) 国际公布号
WO 2023/213182 A1

(43) 国际公布日
2023 年 11 月 9 日 (09.11.2023)

(51) 国际专利分类号:

C07D 211/46 (2006.01) **A61P 17/00** (2006.01)
A61P 37/08 (2006.01) **A61K 31/445** (2006.01)
A61P 11/02 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2023/088517

(22) 国际申请日: 2023 年 4 月 14 日 (14.04.2023)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202210486129.2 2022 年 5 月 6 日 (06.05.2022) CN

(71) 申请人: 成都施贝康生物医药科技有限公司 (CHENGDU SHIBEIKANG BIOMEDICAL TECHNOLOGY CO., LTD.) [CN/CN]; 中国四川省成都市高新区天宇路 2 号 26 栋 1 单元 1 号, Sichuan 611730 (CN)。

(72) 发明人: 曾燕群 (CENG, Yanqun); 中国四川省成都市高新区天宇路 2 号 26 栋 1 单元 1 号, Sichuan 611730 (CN)。周广林 (ZHOU, Guanglin); 中国四川省成都市高新区天宇路 2 号 26 栋 1 单元 1 号, Sichuan 611730 (CN)。付海霞 (FU, Haixia); 中国四川省成都市高新区天宇路 2 号 26 栋 1 单元 1 号, Sichuan 611730 (CN)。牟霞 (MOU, Xia); 中国四川省成都市高新区天宇路 2 号 26 栋 1 单元 1 号, Sichuan 611730 (CN)。

(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家

保护): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MU, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW。

(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区

保护): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。

(54) Title: CAREBASTINE SALT AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种卡瑞斯汀的盐及其用途

(57) Abstract: The present invention relates to the field of pharmaceutical chemistry, and in particular, to a carebastine salt and use thereof. The present invention solves the problems of solid carebastine in the prior art such as poor form, excessive impurities, instability, difficulties in purification, scale-up and synthesis, and low druggability. The carebastine salt of the present invention includes, but is not limited to, an acid addition salt or a base addition salt, and particularly includes a potassium salt, a sodium salt, a methanesulfonate, and a p-toluenesulfonate. The carebastine salt of the present invention possesses use in preparing a medicament as a histamine H1 receptor antagonist. The carebastine salt of the present invention has characteristics such as ease of purification, high stability, simple process, ease of industrial production and the like, and has good hygroscopicity and convenience in storage. Also, the salt of the present invention can quickly enter a body to exert its efficacy, features good oral absorption performance and superior safety and individual difference to ebastine, and is a very promising antiallergic.

(57) 摘要: 本发明公开了一种卡瑞斯汀的盐及用途, 涉及药物化学领域, 解决现有技术中卡瑞斯汀固体形态差、杂质多、不稳定、不易提纯、不易放大合成, 不适用于药用等问题。本发明的卡瑞斯汀盐包括但不限于酸盐或碱盐, 尤其包括钾盐、钠盐、甲磺酸盐和对甲苯磺酸盐。本发明的卡瑞斯汀的盐具备制备组胺 H1 受体拮抗剂的药物中的用途。本发明的卡瑞斯汀盐, 容易提纯、稳定性高、工艺简单且易工业化生产等特点, 并且具有较好的引湿性特征, 方便储存; 同时本发明的盐可快速进入体内发挥药效作用, 口服吸收好, 安全性及个体差异均优于依巴斯汀, 是一种很有发展前途的抗过敏性疾病的药物。

WO 2023/213182 A1