

(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 2025/031344 A1

(43) 国际公布日
2025 年 2 月 13 日 (13.02.2025)

(51) 国际专利分类号:

C07D 487/04 (2006.01) **A61P 35/00** (2006.01)
A61K 31/4985 (2006.01) **A61P 37/00** (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/110036

(22) 国际申请日: 2024 年 8 月 6 日 (06.08.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

PCT/CN2023/111497

2023 年 8 月 7 日 (07.08.2023) CN

(71) 申请人: 广州麓鹏制药有限公司 (GUANGZHOU LUPENG PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [CN/CN]; 中国广东省广州市黄埔区科学大道 33 号 B 座 616 房, Guangdong 510700 (CN)。

(72) 发明人: 叶辉青 (YE, Huiqing); 中国广东省广州市黄埔区科学大道 33 号 B 座 616 房, Guangdong 510700 (CN)。詹宁辛 (ZHAN, Ningxin); 中国广东省广州市黄埔区科学大道 33 号 B 座 616 房, Guangdong 510700 (CN)。武春 (WU, Chun); 中国

广东省广州市黄埔区科学大道 33 号 B 座 616 房, Guangdong 510700 (CN)。徐雪松 (XU, Xuesong); 中国广东省广州市黄埔区科学大道 33 号 B 座 616 房, Guangdong 510700 (CN)。

(74) 代理人: 北京市柳沈律师事务所 (LIU, SHEN & ASSOCIATES); 中国北京市海淀区彩和坊路 10 号 1 号楼 10 层, Beijing 100080 (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

(54) Title: CRYSTAL FORM VI OF ACRYLAMIDE COMPOUND, AND PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 一种丙烯酰胺类化合物的晶型 VI 及其制备方法和用途

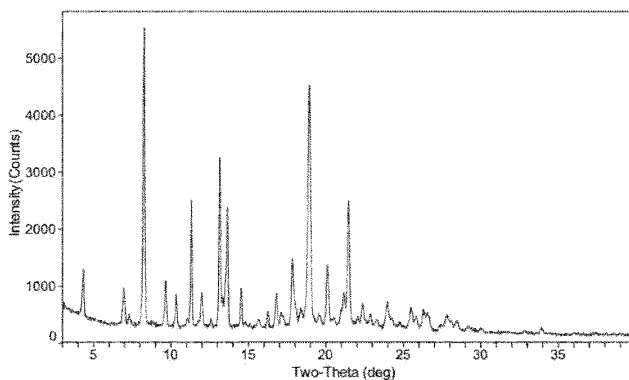


图 1

(57) Abstract: Provided is a crystal form VI of an acrylamide compound. The acrylamide compound is an (S)-N-((6-(7,7-dimethyl-1-oxo-1,3,4,6,7,8-hexahydro-2H-cyclopentane[4,5]pyrrolo[1,2-a]pyrazin-2-yl)-3-(hydroxymethyl)pyridin-4-yl)-4-methyl-3-oxo-3,4-dihydropyrazin-2-yl)amino)-2-(2-methyl-4-(tetrahydro-2H-pyran-4-yl)piperazin-1-yl)-5-phenylacrylamide compound, and the X-ray powder diffraction pattern of the crystal form VI has diffraction peaks at the following 2 θ angle values: 8.3 $\pm$ 0.2 $^{\circ}$, 13.2 $\pm$ 0.2 $^{\circ}$ and 18.9 $\pm$ 0.2 $^{\circ}$. The crystal form VI has the advantages of good stability and low hygroscopicity, and is suitable for industrial production of bulk drugs and formulation development of preparations.

[见续页]



WO 2025/031344 A1

(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))。

(57) 摘要: 提供一种丙烯酰胺类化合物的晶型VI, 所述丙烯酰胺类化合物为(S)-N-(5-((6-(2-(7,7-二甲基-1-氧代-1,3,4,6,7,8-六氢-2H-环戊烷[4,5]吡咯并[1,2-a]吡嗪-2-基)-3-(羟甲基)吡啶-4-基)-4-甲基-3-氧代-3,4-二氢吡嗪-2-基)氨基)-2-(2-甲基-4-(四氢-2H-吡喃-4-基)哌嗪-1-基)5-苯基)丙烯酰胺化合物, 晶型VI的X射线粉末衍射图谱包含以下2θ角度值的衍射峰: $8.3 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.2 \pm 0.2^\circ$ 和 $18.9 \pm 0.2^\circ$ 。晶型VI具有稳定性好, 引湿性低的优点, 适合进行原料药工业生产以及制剂处方开发。