

(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국

(43) 국제공개일
2025년 6월 12일 (12.06.2025)



(10) 국제공개번호
WO 2025/121900 A1

- (51) 국제특허분류:
C07D 487/04 (2006.01) A61K 31/519 (2006.01)
- (21) 국제출원번호: PCT/KR2024/019814
- (22) 국제출원일: 2024년 12월 5일 (05.12.2024)
- (25) 출원언어: 한국어
- (26) 공개언어: 한국어
- (30) 우선권정보:
10-2023-0174736 2023년 12월 5일 (05.12.2023) KR
10-2023-0174738 2023년 12월 5일 (05.12.2023) KR
10-2024-0006933 2024년 1월 16일 (16.01.2024) KR
10-2024-0164590 2024년 11월 18일 (18.11.2024) KR
- (71) 출원인: 주식회사 대웅제약 (DAEWOONG PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [KR/KR]; 18623 경기도 화성시 향남읍 제약공단4길 35-14 (KR).
- (72) 발명자: 박준석 (PARK, Joon Seok); 17000 경기도 용인시 기흥구 동백평촌로 15, #1403-302 (KR). 현해정 (HYUN, Hyae Jung); 13568 경기도 성남시 분당구 양현로94번길 28, #305-102 (KR). 이준환 (LEE, Joon-Hwan); 16693 경기도 수원시 영통구 영통로200번길

- 112, #103-2401 (KR). 전선아 (JUN, Sun Ah); 17027 경기도 용인시 처인구 포곡읍 포곡로 150, #106-1304 (KR). 김남윤 (KIM, Namyoun); 17002 경기도 용인시 기흥구 동백평촌로 70, #1001-703 (KR). 김원선 (KIM, Wonsun); 18430 경기도 화성시 동탄숲속로 68, #873-2902 (KR). 김철웅 (KIM, Cheolwoong); 16684 경기도 수원시 영통구 덕영대로 1410, #105-1502 (KR).
- (74) 대리인: 유미특허법인 (YOU ME PATENT AND LAW FIRM); 06134 서울특별시 강남구 테헤란로 115 (KR).
- (81) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 권리의 보호를 위하여): 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, 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.

(54) Title: PHOSPHATE SALT OF 1-((3S,4R)-3-((2-((1-ETHYL-1H-PYRAZOL-4-YL)AMINO)-7H-PYRROLO[2,3-D]PYRIMIDIN-4-YL)OXY)-4-FLUOROPIPERIDIN-1-YL)PROP-2-EN-1-ONE, CRYSTALLINE FORM THEREOF, AND METHOD FOR PREPARATION THEREOF

(54) 발명의 명칭: 1-((3S,4R)-3-((2-((1-에틸-1H-피라졸-4-일)아미노)-7H-피롤로[2,3-D]피리미딘-4-일)옥시)-4-플루오로피페리딘-1-일)프로프-2-엔-1-온의 인산염, 이의 결정형 및 이의 제조 방법

No.	Pos. [°2θ]	d-spacing [Å]	Height [cts]	Ref. Int. [%]	PYRIM/LPYR [2θ]	Height [cps]
1	3.9431	22.4058	394.66	57.18	0.1781	20.81
2	7.8112	11.2764	286.43	37.44	0.1781	13.7
3	8.5932	10.25024	359.76	52.12	0.2558	19.07
4	9.2422	9.56899	428.23	61.75	0.2814	22.59
5	10.0573	8.76654	252.86	36.03	0.1023	13.4
6	10.2022	8.64651	266.35	37.43	0.1509	13.67
7	11.3777	7.77735	28.62	4.18	0.5117	1.53
8	12.6265	6.90195	244.18	35.38	0.2558	12.94
9	14.4208	6.14237	208.63	30.23	0.2558	11.06
10	15.8895	5.59496	483.75	70.09	0.0768	25.64
11	16.0677	5.51921	643.51	93.23	0.1663	34.1
12	16.5209	5.35591	205.26	29.74	0.1023	10.88
13	17.1081	5.18274	142.56	20.65	0.2303	7.55
14	17.5905	5.04198	219.38	31.78	0.2303	11.63
15	18.7771	4.72553	64.52	9.35	0.1781	3.42
16	19.5423	4.54258	287.12	38.7	0.2047	14.16
17	20.477	4.33729	260.88	37.79	0.1535	13.82
18	20.898	4.25862	408.55	59.2	0.1535	21.65
19	21.2101	4.189	619.39	89.74	0.1791	32.62
20	21.6503	4.10296	631.6	91.51	0.1278	33.47
21	22.369	3.97454	367.04	53.18	0.2558	19.45
22	22.917	3.86072	238.99	34.63	0.2303	12.67
23	23.4195	3.76538	315.15	45.96	0.1023	16.7
24	24.3426	3.65659	223.35	32.36	0.2558	11.84
25	24.9585	3.5676	112.75	16.33	0.2558	5.97
26	25.5548	3.48583	690.23	100	0.2558	36.58
27	26.111	3.41282	115.08	16.67	0.1535	6.1
28	26.8416	3.32156	314.25	45.53	0.2047	16.65
29	27.4326	3.24864	224.34	32.5	0.1248	11.89
30	27.568	3.23567	244.21	35.38	0.1023	12.94
31	28.4006	3.14268	186.56	22.87	0.3562	8.4
32	29.4927	3.02975	120.54	17.46	0.307	6.39
33	31.5186	2.83855	209.78	30.39	0.2047	11.12
34	31.7741	2.81629	178.61	25.88	0.2047	9.47
35	32.6687	2.74119	116.88	16.93	0.2047	6.19
36	34.48	2.60289	25.96	3.33	0.307	1.23
37	34.9822	2.56644	27.72	4.02	0.2558	1.47
38	35.9391	2.49889	97.89	14.18	0.1791	5.19
39	38.5803	2.3331	61.64	6.96	0.1791	3.26
40	40.3962	2.23668	52.37	7.59	0.2047	2.78
41	41.2286	2.18964	41.93	6.08	0.307	2.22
42	42.1994	2.14154	32.32	4.68	0.4093	1.71
43	43.2587	2.09186	28.54	4.13	0.307	1.51
44	43.9128	2.05107	36.88	5.2	0.307	1.9
45	45.3717	1.98891	26	3.77	0.4093	1.38
46	46.6344	1.94789	45.45	6.58	0.307	2.41
47	47.5725	1.91145	25.5	3.69	0.4093	1.35
48	48.6228	1.87258	27.41	3.97	0.5582	1.45

(57) Abstract: The present invention relates to a phosphate salt of 1-((3S,4R)-3-((2-((1-ethyl-1H-pyrazol-4-yl)amino)-7H-pyrrolo[2,3-d] pyrimidin-4-yl)oxy)-4-fluoropiperidin-1-yl)prop-2-en-1-one, a crystalline form thereof, and a method for preparing same. The phosphate salt and the crystalline form have low hygroscopicity and improved stability and solubility, compared to free bases, and thus are suitable for pharmaceutical use. Also, the method for preparing the phosphate or crystalline form, of the present invention, has the advantages of enabling mass production and improving the safety of preparation processes by using a safe material compared to reactants used in conventional preparation methods.

(57) 요약서: 본 발명은 1-((3S,4R)-3-((2-((1-에틸-1H-피라졸-4-일)아미노)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)옥시)-4-플루오로피페리딘-1-일)프로프-2-엔-1-온의 인산염, 이의 결정형 및 이의 제조 방법에 관한 것이다. 상기 인산염 및 결정형은 유리 염기 대비 흡습성이 낮고 안정성과 용해도가 향상되어 약학적으로 사용하기에 적합하다. 또한 본 발명의 상기 인산염 또는 결정형을 제조하는 방법은 대량 생산이 가능하며, 종래의 제조 방법에 사용되는 반응물 대비 안전한 물질을 사용하여 제조 공정의 안전성이 향상된다는 이점이 있다.

[다음 쪽 계속]

(84) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의
역내 권리의 보호를 위하여): ARIPO (BW, CV, GH, GM,
KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ,
UG, ZM, ZW), 유라시아 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ,
TM), 유럽 (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).

공개:

— 국제조사보고서와 함께 (조약 제21조(3))