(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

(43) 国际公布日
2011 年 11 月 17 日 (17.11.2011)

PCT

(10) 国际公布号
WO 2011/140858 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 487/04 (2006.01) *A61P 15/10* (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2011/071725

(22) 国际申请日: 2011 年 3 月 11 日 (11.03.2011)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201010172926.0 2010 年 5 月 10 日 (10.05.2010) CN

(72) 发明人; 及
(71) 申请人 : 刘桂坤 (LIU, Guikun) [CN/CN]; 中国广东省东莞市东城区旗峰路新世纪豪园雅兰居 4E, Guangdong 523123 (CN)。

(74) 代理人: 东莞市华南专利商标事务所有限公司 (DONG GUAN HUA NAN PATENT & TRADEMARK OFFICE CO., LTD); 中国广东省东莞市南城区胜和路华凯大厦 601 室, Guangdong 523071 (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, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, 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, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

根据细则 4.17 的声明:
— 关于发明人身份(细则 4.17(i))
— 关于申请人有权申请并被授予专利(细则 4.17(ii))
— 关于申请人有权要求在先申请的优先权(细则 4.17(iii))
— 发明人资格(细则 4.17(iv))

本国际公布:
— 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。

(54) Title: AILDENAFIL CITRATE CRYSTAL FORM O, PREPARATION METHOD AND USE THEREOF

(54) 发明名称 : 枸橼酸爱地那非晶型 O 及其制备方法和应用

(57) Abstract: 1-[3-(6,7-dihydro-1-methyl-7-oxo-3-propyl-1H-pyrazol[4,3-d] pyridin-5-yl)-4-ethoxybenzene sulfonyl]-cis-3,5-lupetazin citrate or Aildenafil citrate crystal form O and the preparation method thereof are provided. The pharmaceutical compositions containing Aildenafil citrate crystal form O and the use thereof in preparing the drugs for treating male erectile dysfunction (ED) are also provided. The crystal form O can be prepared by the steps of: dissolving the raw material, Aildenafil citrate, in the mixed solution of distillation water and tetrahydrofuran, stirring, raising temperature, filtering, stirring filtrate, reducing temperature, holding temperature, crystallizing, filtering, and so on. Drugs can be prepared from the crystal form O together with the pharmaceutically acceptable excipients, and then used in treating male sexual dysfunction disease.

(57) 摘要:

提供了 1-[3-(6，7-二氢-1-甲基-7-氧代-3-丙基-1H-吡唑并[4，3-d]嘧啶-5-基)-4-乙氧基苯磺酰基]-顺式-3，5-二甲基哌嗪枸橼酸盐或枸橼酸爱地那非（Aildenafil citrate）晶型 O 及其制备方法。还提供了含有枸橼酸爱地那非晶型 O 的药物组合物及其在制造治疗男性勃起功能障碍（ED）的药物中的用途。可通过将原料枸橼酸爱地那非溶于蒸馏水与四氢呋喃的混合溶液中，搅拌、升温、过滤、搅拌滤液、降温、保温、结晶、过滤等步骤来制备所述的晶型 O。可由该晶型 O 与药学上可接受的赋形剂来制备药物，然后用于治疗男性性功能障碍疾病。

WO 2011/140858 A1