

(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 2020/253875 A1

(43) 国际公布日
2020 年 12 月 24 日 (24.12.2020) **WIPO | PCT**

(51) 国际专利分类号:

C07D 401/14 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01) *A61P 35/02* (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)

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。

(21) 国际申请号: PCT/CN2020/097482

(22) 国际申请日: 2020 年 6 月 22 日 (22.06.2020)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

201910542355.6 2019年6月21日 (21.06.2019) CN

(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, RW, 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, 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)。

(71) 申请人: 甘李药业股份有限公司 (GAN & LEE
PHARMACEUTICALS) [CN/CN]; 中国北京市通州
区潮县镇南凤西一路8号, Beijing 101109 (CN)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。

(72) 发明人: 尹磊(YIN, Lei); 中国北京市通州区潮县
镇南凤西一路8号, Beijing 101109 (CN)。 姚郑
林(YAO, Zhenglin); 中国北京市通州区潮县镇南
凤西一路8号, Beijing 101109 (CN)。

(74) 代理人: 中科专利商标代理有限责任公
司(CHINA SCIENCE PATENT & TRADEMARK
AGENT LTD.); 中国北京市海淀区西三环北路
87号4-1105室, Beijing 100089 (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,
CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,
GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS,
JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK,
LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX,
MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL,

(54) Title: SALTS OF COMPOUND, CRYSTALLINE FORMS THEREOF, PREPARATION METHOD THEREFOR AND AP-
PLICATION THEREOF

(54) 发明名称: 一种化合物的盐、其晶型以及制备方法与应用

(57) Abstract: Disclosed are a fumaric acid salt, a maleic acid salt, an adipic acid salt, a succinic acid salt, a plurality of crys-
talline forms of a compound 5-fluorine-4-(7'-fluorine-2'-methyl spiro [cyclopentane-1,3'-indol]-5'-yl)-nitrogen-(5-(1-methylpiperi-
dine-4-yl)pyridine-2-yl)pyrimidine-2-amine, a preparation method therefor and an application thereof. It has been proved that the salts
or the crystalline forms thereof can replace 5-fluorine-4-(7'-fluorine-2'-methyl spiro [cyclopentane-1,3'-indol]-5'-yl)-nitrogen-(5-(1-me-
thylpiperidine-4-yl)pyridine-2-yl)pyrimidine-2-amine better, overcome the defects thereof such as the solubility, high risk of food effect
and stability, and have low hygroscopicity and great application value.

(57) 摘要: 化合物 5-氟-4-(7'-氟-2'-甲基螺[环戊烷-1,3'-吡啶]-5'-基)-氮-(5-(1-甲基哌啶-4-基)吡啶-2-
基)嘧啶-2-胺的富马酸盐、马来酸盐及己二酸盐、琥珀酸盐及多个晶型, 以及其制备方法与应用
被公开, 已证实上述盐或其晶型可以更好地替代 5-氟-4-(7'-氟-2'-甲基螺[环戊烷-1,3'-吡啶]-5'-
基)-氮-(5-(1-甲基哌啶-4-基)吡啶-2-基)嘧啶-2-胺, 克服其在包括溶解性、食物效应风险大及稳定
性等方面的缺陷, 同时具有较低的吸湿性, 具有极大的应用价值。

WO 2020/253875 A1