

(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 2023/040863 A1

(43) 国际公布日
2023 年 3 月 23 日 (23.03.2023)

(51) 国际专利分类号:

C07D 401/14 (2006.01) *A61K 31/444* (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01) *A61P 37/00* (2006.01)

号, Shanghai 201203 (CN)。 扬子江药业集团有限公司(YANGTZE RIVER PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省泰州市扬子江南路1号, Jiangsu 225321 (CN)。

(21) 国际申请号: PCT/CN2022/118594

(22) 国际申请日: 2022 年 9 月 14 日 (14.09.2022)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202111079644.0 2021年9月15日 (15.09.2021) CN

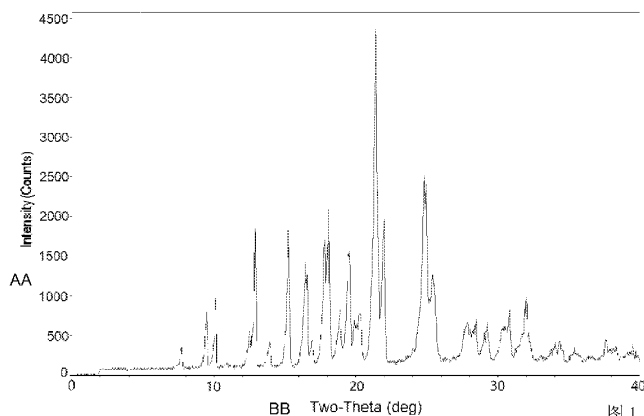
(71) 申请人: 上海海雁医药科技有限公司 (SHANGHAI HAIYAN PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY CO., LTD.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路67弄8

(72) 发明人: 赵双妮(ZHAO, Shuangni); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路67弄8号, Shanghai 201203 (CN)。 江涛涛(JIANG, Taotao); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路67弄8号, Shanghai 201203 (CN)。 王吉标(WANG, Jibiao); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路67弄8号, Shanghai 201203 (CN)。 陶涛(TAO, Tao); 中国上海市浦东新区张江高科技园区李冰路67弄8号, Shanghai 201203 (CN)。

(74) 代理人: 华进联合专利商标代理有限公司 (ADVANCE CHINA IP LAW OFFICE); 中国广东省广州市天河区珠江东路6号4501房 (部

(54) Title: POLYMORPH AND APPLICATION OF PYRIMIDINE DERIVATIVE AND PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE SALT THEREOF

(54) 发明名称: 嘧啶衍生物及其药学上可接受的盐的多晶型物和应用



AA Intensity (Counts)
BB Two-Theta (deg)

图 1

(57) Abstract: Provided is a polymorph and application of a pyrimidine derivative and a pharmaceutically acceptable salt thereof. The polymorph and application of the pyrimidine derivative that is an A_{2A}/A_{2B} dual receptor antagonist having the chemical name 3-(4-amino-5-fluoro-6-(1-((6-(2-hydroxypropan-2-yl)pyridin-2-yl)methyl)-1H-1,2,3-triazol-4-yl)pyrimidin-2-yl)-2-methylbenzonitrile and the pharmaceutically acceptable salt thereof.

(57) 摘要: 提供了一种嘧啶衍生物及其药学上可接受的盐的多晶型物和应用。该嘧啶衍生物是一种 A_{2A}/A_{2B} 双重受体拮抗剂, 化学名称为 3-(4-氨基-5-氟-6-(1-((6-(2-羟基丙烷-2-基)吡啶-2-基)甲基)-1H-1,2,3-三唑-4-基)嘧啶-2-基)-2-甲基苯甲腈及其药学上可接受盐的多晶型物和应用。

[见续页]



WO 2023/040863 A1

位：自编 01-03 和 08-12 单元）（仅限办公用途），Guangdong 510623 (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, ME, MG, MK, MN, 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, 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)。

本国际公布：

— 包括国际检索报告 (条约第 21 条 (3))。