

(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 2025/140586 A1

(43) 国际公布日
2025 年 7 月 3 日 (03.07.2025)

(51) 国际专利分类号:

<i>A61K 9/20</i> (2006.01)	<i>A61P 13/02</i> (2006.01)
<i>A61K 9/28</i> (2006.01)	<i>A61P 13/08</i> (2006.01)
<i>A61K 31/427</i> (2006.01)	<i>A61P 13/10</i> (2006.01)
<i>A61K 31/506</i> (2006.01)	<i>A61P 15/00</i> (2006.01)
<i>C07D 417/12</i> (2006.01)	<i>A61P 25/00</i> (2006.01)
<i>A61P 11/00</i> (2006.01)	<i>A61P 25/04</i> (2006.01)
<i>A61P 11/06</i> (2006.01)	<i>A61P 25/02</i> (2006.01)
<i>A61P 11/14</i> (2006.01)	<i>A61P 25/06</i> (2006.01)
<i>A61P 13/00</i> (2006.01)	<i>A61P 29/00</i> (2006.01)

202411907674.X 2024年12月23日 (23.12.2024) CN

(71) 申请人: 人福医药集团股份有限公司(**HUMANWELL HEALTHCARE (GROUP) CO., LTD.**) [CN/CN]; 中国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。武汉人福创新药物研发中心有限公司(**WUHAN HUMANWELL INNOVATIVE DRUG RESEARCH AND DEVELOPMENT CENTER LIMITED COMPANY**) [CN/CN]; 中国湖北省武汉市东湖新技术开发区高新大道666号C7栋705-2室430075 (CN)。

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/143259

(22) 国际申请日: 2024 年 12 月 27 日 (27.12.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
202311872796.5 2023年12月29日 (29.12.2023) CN

(72) 发明人: 宋豪源(**SONG, Haoyuan**); 中国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。杨以平(**YANG, Yiping**); 中国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。曹雪腾(**CAO, Xueting**); 中国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。黄翔(**HUANG, Xiang**); 中

(54) **Title:** SOLID DISPERSION OF P2X3 RECEPTOR ANTAGONIST AND PREPARATION PROCESS THEREOF

(54) 发明名称: 一种P2X3受体拮抗剂的固体分散体及其制备工艺

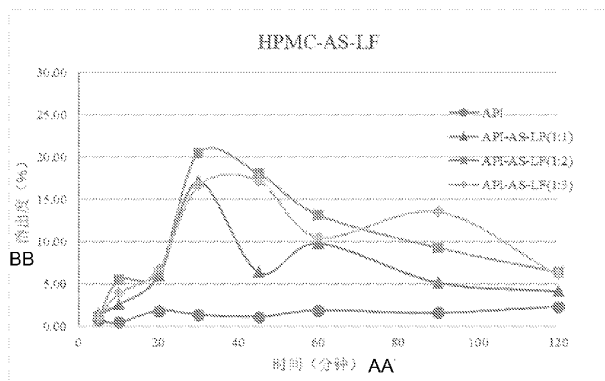


图 3

AATime (min)
BBDissolution rate (%)

(57) **Abstract:** Provided is a solid dispersion containing a P2X3 receptor antagonist compound shown in formula I, which can increase the solubility of the compound shown in formula I, and improve the dissolution rate and bioavailability of the drug, ensuring the therapeutic effect of the drug. Meanwhile, the solid dispersion has good stability. During the storage process, the solid dispersion does not experience crystal form transformation and does not exhibit a significant increase in related substances, which improves the safety of the clinical use of the drug.

(57) **摘要:** 一种包含式I所示的P2X3受体拮抗剂化合物的固体分散体, 能够提高式I所示化合物的溶解性, 提高药物的溶出度和生物利用度, 确保了药物的治疗效果。同时, 固体分散体稳定性好, 储存过程中, 未发生晶型转化, 以及有关物质未出现明显增长, 提高了药物临床应用的安全性。

[见续页]

国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。徐泽彬(XU, Zebin); 中国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。胡慧(HU, Hui); 中国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。金莹(JIN, Ying); 中国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。张博(ZHANG, Bo); 中国湖北省武汉市东湖高新区高新大道666号430075 (CN)。

(74) 代理人: 北京市道可特律师事务所 (BEIJING DOCVIT LAW FIRM); 中国北京市朝阳区东三环中路5号财富金融中心56层01-2室 100022 (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 (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))。