

(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 2025/119398 A1

(43) 国际公布日
2025 年 6 月 12 日 (12.06.2025)

(51) 国际专利分类号:

C07J 71/00 (2006.01) **A61P 37/06** (2006.01)
A61K 31/58 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/137914

(22) 国际申请日: 2024 年 12 月 9 日 (09.12.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202311688572.9 2023 年 12 月 8 日 (08.12.2023) CN

(71) 申请人: 浙江柏拉阿图医药科技有限公司(ZHEJIANG PALO ALTO PHARMACEUTICALS, INC.) [CN/CN]; 中国浙江省衢州市凯旋南路 6 号 1 幢 A-118 室 324099 (CN)。

(72) 发明人: 席志坚(XI, Zhijian); 中国浙江省衢州市凯旋南路 6 号 1 幢 A-118 室 324099 (CN)。陆春平(LU, Chunping); 中国浙江省衢州市凯旋南路 6 号 1 幢 A-118 室 324099 (CN)。曹建新(CAO, Jianxin); 中国浙江省衢州市凯旋南路 6 号 1 幢 A-118 室 324099 (CN)。虞华(YU, Hua); 中国浙江省衢州市凯旋南路 6 号 1 幢 A-118 室 324099 (CN)。

(74) 代理人: 上海一平知识产权代理有限公司(XU & PARTNERS, LLC.); 中国上海市普陀区真北路 958 号天地科技广场 1 号楼 106 室 200333 (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

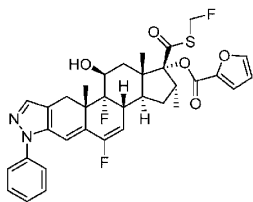
保护): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, 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))。

(54) Title: HIGH-EFFICACY GLUCOCORTICOID POLYMORPH, PREPARATION METHOD THEREFOR, AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 高效力糖皮质激素多晶型及其制备方法和用途



(I)

(57) Abstract: The present invention relates to a novel polymorph of (1R,2R,3aS,3bR,10aS,10bR,11S,12aS)-5,10b-difluoro-1-(((fluoromethyl)thio)carbonyl)-11-hydroxyl-2,10a,12a-trimethyl-7-phenyl-1,2,3,3a,3b,7,10,10a,10b,11,12,12a-dodecylhydrocyclopenta[5,6]naphtho[1,2-F]indazole-1-furan-2-carboxylate ester as shown in formula (I), a preparation method therefor, and a use thereof. The crystal form of the present invention has characteristics such as a significant pharmaceutical effect, good stability, high yield, and high purity, and is beneficial for the selection and design of a drug administration route and the determination of a drug preparation process parameter, thereby improving drug production quality.

(57) 摘要: 本发明涉及式(I)所示(1R, 2R, 3aS, 3bR, 10aS, 10bR, 11S, 12aS)-5, 10b-二氟-1-(((氟甲基)硫基)羰基)-11-羟基-2, 10a, 12a-三甲基-7-苯基-1, 2, 3, 3a, 3b, 7, 10, 10a, 10b, 11, 12, 12a-十二烷基氢环戊[5, 6]萘并[1, 2-F]吡唑-1-基呋喃-2-羧酸酯的新多晶型及其制备方法和用途。本发明晶型具有药效显著, 稳定性好, 收率高, 纯度高等特点, 有助于药物给药途径的选择与设计, 以及药物制剂工艺参数的确定, 从而提高药品生产质量。

WO 2025/119398 A1