

(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국

(43) 국제공개일
2025년 6월 12일 (12.06.2025)



(10) 국제공개번호
WO 2025/121903 A1

- (51) 국제특허분류:
C07D 487/04 (2006.01) A61K 31/519 (2006.01)
- (21) 국제출원번호: PCT/KR2024/019820
- (22) 국제출원일: 2024년 12월 5일 (05.12.2024)
- (25) 출원언어: 한국어
- (26) 공개언어: 한국어
- (30) 우선권정보:
10-2023-0174736 2023년 12월 5일 (05.12.2023) KR
10-2023-0174737 2023년 12월 5일 (05.12.2023) KR
10-2024-0006933 2024년 1월 16일 (16.01.2024) KR
10-2024-0164582 2024년 11월 18일 (18.11.2024) KR
- (71) 출원인: 주식회사 대웅제약 (DAEWOONG PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [KR/KR]; 18623 경기도 화성시 향남읍 제약공단4길 35-14 (KR).

- (72) 발명자: 박준석 (PARK, Joon Seok); 17000 경기도 용인시 기흥구 동백평촌로 15, #1403-302 (KR). 현해정 (HYUN, Hyae Jung); 13568 경기도 성남시 분당구 양현로94번길 28, #305-102 (KR). 이준환 (LEE, Joon-Hwan); 16693 경기도 수원시 영통구 영통로200번길 112, #103-2401 (KR). 전선아 (JUN, Sun Ah); 17027 경기도 용인시 처인구 포곡읍 포곡로 150, #106-1304 (KR). 김남윤 (KIM, Namyoun); 17002 경기도 용인시 기흥구 동백평촌로 70, #1001-703 (KR). 김원선 (KIM, Wonsun); 18430 경기도 화성시 동탄숲속로 68, #873-2902 (KR). 김철웅 (KIM, Cheolwoong); 16684 경기도 수원시 영통구 덕영대로 1410, #105-1502 (KR).
- (74) 대리인: 유미특허법인 (YOU ME PATENT AND LAW FIRM); 06134 서울특별시 강남구 테헤란로 115 (KR).
- (81) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 권리의 보호를 위하여): AE, AG, AL, AM, AO, AT,

(54) Title: TARTRATE SALT OF 1-((3S,4R)-3-((2-((1-ETHYL-1H-PYRAZOL-4-YL)AMINO)-7H-PYRROLO[2,3-D]PYRIMIDIN-4-YL)OXY)-4-FLUOROPIPERIDIN-1-YL)PROP-2-EN-1-ONE, CRYSTALLINE FORM THEREOF, AND METHOD FOR PREPARING SAME

(54) 발명의 명칭: 1-((3S,4R)-3-((2-((1-에틸-1H-피라졸-4-일)아미노)-7H-피롤로[2,3-D]피리미딘-4-일)옥시)-4-플루오로피페리딘-1-일)프로프-2-엔-1-온의 타타르산염, 이의 결정형 및 이의 제조 방법

No.	Pos. [°2θ]	d-spacing [Å]	Height [cts]	Rel. Int. [%]	Height [cps]
1	5.2391	16.86824	1968.41	100	104.31
2	6.5315	13.53293	55.5	2.82	2.94
3	8.0709	10.95486	1414.3	71.85	74.95
4	9.5242	9.28629	107.27	5.45	5.68
5	10.4191	8.49064	314.93	16	16.69
6	12.5736	7.04018	257.6	13.09	13.65
7	13.1717	6.7218	168.52	8.56	8.93
8	13.7764	6.42812	170.39	8.66	9.03
9	15.4949	5.71884	150.65	7.65	7.98
10	16.566	5.35141	392.01	19.92	20.77
11	16.9806	5.22168	882.34	44.83	46.76
12	17.9787	4.93387	505.61	25.69	26.79
13	18.3679	4.82248	478.21	24.34	25.4
14	18.8081	4.71622	162.22	8.24	8.6
15	19.1669	4.6307	74.7	3.79	3.96
16	19.6171	4.52544	171.11	8.69	9.07
17	20.1893	4.39846	266.37	13.53	14.12
18	20.5328	4.32563	290.85	14.78	15.41
19	21.3841	4.15531	358.64	18.22	19.01
20	21.6749	4.10022	679.95	34.54	36.03
21	23.6611	3.76034	171.54	8.71	9.09
22	24.2448	3.67111	180.19	9.15	9.55
23	25.2551	3.5265	251.78	12.79	13.34
24	26.0287	3.42342	122.71	6.23	6.5
25	27.1815	3.28079	162.39	8.25	8.61
26	27.8045	3.20868	200.92	10.21	10.65
27	29.4977	3.02824	59.5	3.02	3.15
28	30.3184	2.94811	123.81	6.29	6.56
29	31.8655	2.80842	51.15	2.6	2.71
30	33.3002	2.68063	42.62	2.17	2.26
31	35.1996	2.54968	21.05	1.07	1.12
32	35.9126	2.50067	23.28	1.18	1.23
33	38.1927	2.36647	41.88	2.13	2.22
34	38.9996	2.30955	26.79	1.36	1.42
35	41.9932	2.15157	60.69	3.08	3.22

(57) Abstract: The present invention relates to a tartrate salt of 1-((3S,4R)-3-((2-((1-ethyl-1H-pyrazol-4-yl)amino)-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)oxy)-4-fluoropiperidin-1-yl)prop-2-en-1-one, a crystalline form thereof, and a method for preparing same. The tartrate salt and the crystalline form have lower hygroscopicity and improved stability and solubility compared to a free base, and thus are suitable for pharmaceutical use. In addition, the method for preparing the tartrate salt or crystalline form of the present invention has the advantage of enabling mass production and improving the safety of the preparation process by using safer substances than reactants

[다음 쪽 계속]

WO 2025/121903 A1

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, 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) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 역내 권리의 보호를 위하여): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 유라시아 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 유럽 (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).

공개:

— 국제조사보고서와 함께 (조약 제21조(3))
used in conventional preparation methods.

(57) 요약서: 본 발명은 1-((3S,4R)-3-((2-((1-에틸-1H-피라졸-4-일)아미노)-7H-피롤로[2,3-d]피리미딘-4-일)옥시)-4-플루오로피페리딘-1-일)프로프-2-엔-1-온의 타타르산염, 이의 결정형 및 이의 제조 방법에 관한 것이다. 상기 타타르산염 및 결정형은 유리 염기 대비 흡습성이 낮고 안정성과 용해도가 향상되어 약학적으로 사용하기에 적합하다. 또한 본 발명의 상기 타타르산염 또는 결정형을 제조하는 방법은 대량 생산이 가능하며, 종래의 제조 방법에 사용되는 반응물 대비 안전한 물질을 사용하여 제조 공정의 안전성이 향상된다는 이점이 있다.