

(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 2024/188273 A1

(43) 国际公布日
2024 年 9 月 19 日 (19.09.2024)

(51) 国际专利分类号:

C07D 401/14 (2006.01) **A61K 31/4155** (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01) **A61P 3/10** (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2024/081449

(22) 国际申请日: 2024 年 3 月 13 日 (13.03.2024)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202310245157.X 2023 年 3 月 13 日 (13.03.2023) CN

(71) 申请人: 华领医药技术 (上海) 有限公司 (**HUA MEDICINE (SHANGHAI) LTD.**) [CN/CN]; 中国上海市自由贸易试验区爱迪生路 275 号, Shanghai 201203 (CN)。

(72) 发明人: 余劲 (**SHE, Jin**); 中国上海市浦东新区学林路 36 弄 2 号楼, Shanghai 201203 (CN)。靳向东 (**JIN, Xiangde**); 中国上海市浦东新区学林路 36 弄 2 号楼, Shanghai 201203 (CN)。赵强 (**ZHAO, Qiang**); 中国上海市浦东新区学林路 36 弄 2 号楼, Shanghai 201203 (CN)。胡彬 (**HU, Bin**); 中国上海市浦东新区学林路 36 弄 2 号楼, Shanghai 201203 (CN)。陈力 (**CHEN, Li**); 中国上海市浦东新区学林路 36 弄 2 号楼, Shanghai 201203 (CN)。

(74) 代理人: 北京市柳沈律师事务所 (**LIU, SHEN & ASSOCIATES**); 中国北京市海淀区彩和坊路 10 号 1 号楼 10 层, Beijing 100080 (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。

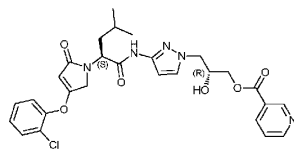
(84) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, CV, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SC, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 欧洲 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, ME, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, 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:** SOLID FORM OF PYRROLIDONE DERIVATIVE AS GLUCOKINASE ACTIVATOR

(54) 发明名称: 作为葡萄糖激酶激活剂的吡咯烷酮衍生物的固体形式



(57) **Abstract:** The present invention relates to a crystal form of a free state of (R)-3-(3-((S)-2-(4-(2-chlorophenoxy)-2-oxo-2,5-dihydro-1H-pyrrol-1-yl)-4-methylpentanoylamino)-1H-pyrazol-1-yl)-2-hydroxypropyl nicotinate (compound A) or a pharmaceutically acceptable salt thereof, a pharmaceutical composition and a preparation method thereof, and a use of the crystal form in the preparation of a medicament for treating diabetes (A) and related symptoms.

(57) 摘要: 本发明涉及 (R)-3-(3-((S)-2-(4-(2-氯苯氧基)-2-氧代-2,5-二氢-1H-吡咯-1-基)-4-甲基戊酰氨基)-1H-吡唑-1-基)-2-羟基丙基烟酸酯 (化合物 A) 的游离态或其药学上可接受盐的晶型, 及其药物组合物和制备方法, 以及所述晶型在制备用于治疗糖尿病及相关症状中的用途。

WO 2024/188273 A1