

(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

(43) 国际公布日
2012 年 9 月 27 日 (27.09.2012)



(10) 国际公布号
WO 2012/126386 A1

(51) 国际专利分类号:

C07C 233/18 (2006.01) A61P 25/00 (2006.01)
C07C 231/24 (2006.01) A61P 9/00 (2006.01)
A61K 31/165 (2006.01) A61P 1/00 (2006.01)
A61P 25/20 (2006.01) A61P 25/24 (2006.01)
A61P 25/22 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2012/072818

(22) 国际申请日: 2012 年 3 月 22 日 (22.03.2012)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201110070634.0 2011 年 3 月 23 日 (23.03.2011) CN

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): 上海医药工业
研究院 (SHANGHAI INSTITUTE OF PHARMA-
CEUTICAL INDUSTRY) [CN/CN]; 中国上海市静安
区北京西路 1320 号, Shanghai 200040 (CN)。瑟维
尔实验室 (LES LABORATOIRES SERVIER)
[FR/FR]; 法国苏雷斯尼市凡尔登大街 35 号, F-92884
(FR)。

(72) 发明人: 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): 黄雨 (HUANG, Yu)
[CN/CN]; 中国上海市静安区北京西路 1320 号,
Shanghai 200040 (CN)。龙青 (LONG, Qing)
[CN/CN]; 中国上海市静安区北京西路 1320 号,
Shanghai 200040 (CN)。朱雪焱 (ZHU, Xueyan)
[CN/CN]; 中国上海市静安区北京西路 1320 号,
Shanghai 200040 (CN)。单汉滨 (SHAN, Hanbin)
[CN/CN]; 中国上海市静安区北京西路 1320 号,

Shanghai 200040 (CN)。袁哲东 (YUAN, Zhedong)
[CN/CN]; 中国上海市静安区北京西路 1320 号,
Shanghai 200040 (CN)。俞雄 (YU, Xiong) [CN/CN];
中国上海市静安区北京西路 1320 号, Shanghai
200040 (CN)。

(74) 代理人: 北京市中咨律师事务所 (ZHONGZI LAW
OFFICE); 中国北京市西城区平安里西大街 26 号新
时代大厦 7 层, Beijing 100034 (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, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD,
GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU,
LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ,
NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO,
RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY,
TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN,
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, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ,
BY, KG, KZ, MD, 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, 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: MIXED CRYSTAL AGOMELATINE (FORM-VIII), PREPARATION METHOD AND USE THEREOF AND PHAR-
MACEUTICAL COMPOSITION CONTAINING SAME

(54) 发明名称: 阿戈美拉汀的混晶(形式-VIII)、其制备方法、应用和包含其的药物组合物

(57) Abstract: The present invention provides a mixed crystal agomelatine (Form-VIII), the preparation method and use thereof and
a pharmaceutical composition containing the same, wherein the mixed crystal mainly contains an agomelatine crystal form VI. The
mixed crystal is stable and has good reproducibility, and is found through a stability test to be superior to a crystal form VI in terms
of stability. Therefore, the Form-VIII of the present invention has an advantage in terms of preparation.

(57) 摘要: 本发明提供了阿戈美拉汀混晶(形式-VIII)、其制备方法、应用和包含其的药物组合物, 其中所述混晶
主要含阿戈美拉汀VI晶型。该混晶晶型稳定且重现性好, 通过稳定性实验发现在稳定性方面优于VI晶型。因
此, 本发明的形式-VIII在制剂方面具有优势。



WO 2012/126386 A1