

(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 2024/056016 A1

(43) 国际公布日
2024 年 3 月 21 日 (21.03.2024)

- (51) 国际专利分类号:
C07D 487/04 (2006.01) *A61P 25/00* (2006.01)
A61K 31/407 (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2023/118743
- (22) 国际申请日: 2023 年 9 月 14 日 (14.09.2023)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
20221116574.6 2022年9月14日 (14.09.2022) CN
- (71) 申请人: 江苏豪森药业集团有限公司 (JIANGSU HANSON PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省连云港市经济技术开发区, Jiangsu 222047 (CN)。上海翰森生物医药科技有限公司 (SHANGHAI HANSON BIOMEDICAL CO., LTD.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区 (上海) 自由贸易试验区金科路 3728 号 11 幢, Shanghai 201203 (CN)。
- (72) 发明人: 杨彤 (YANG, Tong); 中国上海市浦东新区 (上海) 自由贸易试验区金科路 3728 号 11 幢, Shanghai 201203 (CN)。陈金瑶 (CHEN, Jinyao); 中国上海市浦东新区 (上海) 自由贸易试验区金科路 3728 号 11 幢, Shanghai 201203 (CN)。
- (74) 代理人: 北京戈程知识产权代理有限公司 (GE CHENG & CO., LTD.); 中国北京市东城区东长安街 1 号东方广场东三办公楼 10 层, Beijing 100738 (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,

(54) **Title:** FREE BASE CRYSTAL FORM OF POLYCYCLIC COMPOUND OF NITROGEN-CONTAINING HETEROCYCLE, AND PREPARATION METHOD THEREFOR

(54) 发明名称: 含氮杂环的多环化合物的自由碱晶型及其制备方法

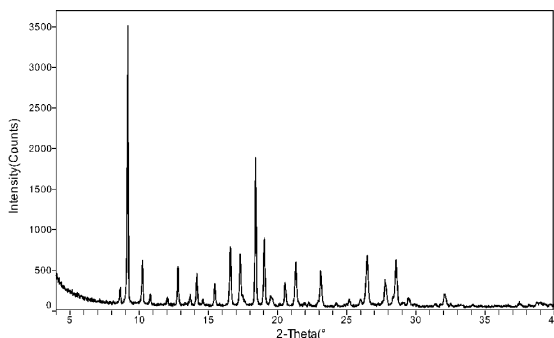
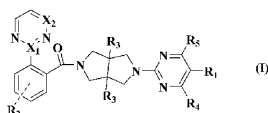


图 1

(57) **Abstract:** The present invention relates to a free base crystal form of a polycyclic compound of a nitrogen-containing heterocycle, and a preparation method therefor. Specifically, the present invention provides a free base crystal form of a compound having general formula (I), a preparation method therefor, a pharmaceutical composition containing a therapeutically-effective amount of the crystal form, and a use thereof as an orexin receptor antagonist in the preparation of drugs for treating nervous system diseases.

[见续页]

WO 2024/056016 A1

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))。

(57) 摘要: 本发明涉及一种含氮杂环的多环化合物的自由碱晶型及其制备方法。具体涉及一种具有通式(I)化合物自由碱的晶型、制备方法和含有治疗有效量的该晶型的药物组合物, 及其作为食欲素受体拮抗剂在制备治疗神经系统疾病相关药物中的用途。