

(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 2023/236877 A1

(43) 国际公布日

2023 年 12 月 14 日 (14.12.2023)

WIPO | PCT

(51) 国际专利分类号:

C07D 493/00 (2006.01) A61P 19/02 (2006.01)
A61K 31/352 (2006.01) A61P 3/10 (2006.01)
A61P 11/06 (2006.01) A61P 37/00 (2006.01)
A61P 11/08 (2006.01) A61P 13/12 (2006.01)

201210 (CN)。郝欣(HAO, Xin); 中国上海市浦东新区自由贸易试验区祥科路 298 号 1 幢 203 室, Shanghai 201210 (CN)。罗志阳(LUO, Zhiyang); 中国上海市浦东新区自由贸易试验区祥科路 298 号 1 幢 203 室, Shanghai 201210 (CN)。

(21) 国际申请号:

PCT/CN2023/098204

(22) 国际申请日:

2023 年 6 月 5 日 (05.06.2023)

(25) 申请语言:

中文

(26) 公布语言:

中文

(30) 优先权:

202210640471.3 2022 年 6 月 7 日 (07.06.2022) CN

(71) 申请人: 瑞石生物医药有限公司 (REISTONE BIOPHARMA COMPANY LIMITED) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区自由贸易试验区祥科路 298 号 1 幢 203 室, Shanghai 201210 (CN)。

(72) 发明人: 孙龙伟(SUN, Longwei); 中国上海市浦东新区自由贸易试验区祥科路 298 号 1 幢 203 室, Shanghai 201210 (CN)。侯延婷(HOU, Yanting); 中国上海市浦东新区自由贸易试验区祥科路 298 号 1 幢 203 室, Shanghai 201210 (CN)。朱嘉俊(ZHU, Jiajun); 中国上海市浦东新区自由贸易试验区祥科路 298 号 1 幢 203 室, Shanghai 201210 (CN)。杨光(YANG, Guang); 中国上海市浦东新区自由贸易试验区祥科路 298 号 1 幢 203 室, Shanghai

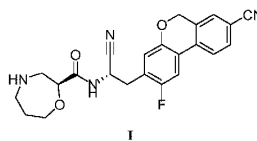
(74) 代理人: 北京戈程知识产权代理有限公司 (GE CHENG & CO., LTD); 中国北京市东城区东长安街 1 号东方广场东三办公楼 10 层, Beijing 100738 (CN)。

(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, 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,

(54) Title: PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE SALT OF BENZO[C]CHROMAN COMPOUND AND POLYMORPHIC FORM AND USE OF PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE SALT

(54) 发明名称: 苯并[c]色满化合物的可药用盐、其多晶型及用途



(57) Abstract: A pharmaceutically acceptable salt of a benzo[c]chroman compound and a polymorphic form and use of the pharmaceutically acceptable salt. The pharmaceutically acceptable salt is selected from hydrochloride, methanesulfonate, phosphate, L-tartrate, maleate, p-toluenesulfonate, sulfate, fumarate, succinate, citrate, malate, and hydrobromide. The pharmaceutically acceptable salt and the polymorphic form thereof improve the bioavailability and the stability, and as a cathepsin C inhibitor, can be used for treating asthma, obstructive pulmonary disease, bronchiectasis, ANCA-associated vasculitis, psoriasis, α 1-antitrypsin deficiency, lupus nephritis, diabetes, inflammatory bowel disease, rheumatoid arthritis, sinusitis, hidradenitis suppurativa, or cancer.

(57) 摘要: 一种苯并[c]色满化合物I的可药用盐、其多晶型及用途。所述可药用盐选自盐酸盐、甲磺酸盐、磷酸盐、L-酒石酸盐、马来酸盐、对甲苯磺酸盐、硫酸盐、富马酸盐、琥珀酸盐、柠檬酸盐、苹果酸盐和氢溴酸盐。所述可药用盐及其多晶型提高了生物利用度和稳定性, 可作为组织蛋白酶C 抑制剂用于治疗气喘、阻塞性肺病、支气管扩张、ANCA 相关性血管炎、银屑病、 α 1-抗胰蛋白酶缺乏症、狼疮性肾炎、糖尿病、炎症性肠病、风湿性关节炎、鼻窦炎、化脓性汗腺炎或癌症。

[见续页]

WO 2023/236877 A1

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))。