(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
2022 年 3 月 17 日 (17.03.2022)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2022/052950 A1

(51) 国际专利分类号:
C07D 487/04 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/117174

(22) 国际申请日: 2021 年 9 月 8 日 (08.09.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202010933538.3	2020年9月9日 (09.09.2020)	CN
202110869600.1	2021年8月3日 (03.08.2021)	CN

(71) 申请人: 海思科医药集团股份有限公司(HAISCO PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国西藏自治区山南地区泽当镇三湘大道17号, Tibet 856000 (CN)。

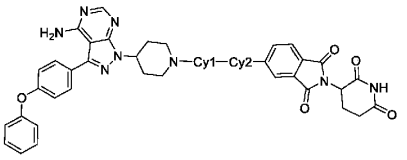
(72) 发明人: 张晨(ZHANG, Chen); 中国西藏自治区山南地区泽当镇三湘大道17号, Tibet 856000 (CN)。 廖雨亭(LIAO, Yuting); 中国西藏自治区山南地区泽当镇三湘大道17号, Tibet 856000 (CN)。 王健民(WANG, Jianmin); 中国西藏自治区山南地区泽当镇三湘大道17号, Tibet 856000 (CN)。 黄龙彬(HUANG, Longbin); 中国西藏自治区山南地区泽当镇三湘大道17号, Tibet 856000 (CN)。 祝国智(ZHU, Guozhi); 中国西藏自治区山南地区泽当镇三湘大道17号, Tibet 856000 (CN)。 李瑶(LI, Yao); 中国西藏自治区山南地区泽当镇三湘大道17号, Tibet 856000 (CN)。 严庞科(YAN, Pangke); 中国西藏自治区山南地区泽当镇三湘大道17号, Tibet 856000 (CN)。

(74) 代理人: 北京坤瑞律师事务所(WU, FENG & ZHANG); 中国北京市海淀区丰秀中路3号院2号楼3层, Beijing 100094 (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, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX,

(54) **Title:** SALT OF COMPOUND FOR DEGRADING BTK, CRYSTAL FORM THEREOF, AND USE THEREOF IN MEDICINE

(54) **发明名称**: 一种降解BTK化合物的盐及其晶型和在医药上的用途



(I)

(57) **Abstract:** Provided are a salt of a compound for degrading BTK, and/or a crystal form, preparation therefor, and an application thereof. The pharmaceutical salt of the compound as shown in formula (I) and the crystal form, wherein the pharmaceutical salt is selected from maleate, fumarate, halogen acid salt (preferably hydrobromide and hydrochloride), sulfate, phosphate, L-tartrate, citrate, L-malate, hippurate, D-glucuronate, glycollate, mucate, succinate, lactate, orotate, pamoate, glycinate, alanine salt, arginine salt, cinnamate, benzoate, benzenesulfonate, p-toluenesulfonate, acetate, propionate, valerianate, triphenyl acetate, L-proline salt, ferulate, 2-hydroxyethanesulfonate, mandelate, nitrate, mesylate, malonate, gentisate, salicylate, oxalate, or glutarate:

(57) **摘要**: 提供了一种降解BTK的化合物的盐和/或晶型及制备和应用。所述如式(I)所示化合物的可药用盐及晶型，其中，可药用盐选自马来酸盐、富马酸盐、氢卤酸盐(优选为氢溴酸盐和盐酸盐)、硫酸盐、磷酸盐、L-酒石酸盐、柠檬酸盐、L-苹果酸盐、马尿酸盐、D-葡萄糖醛酸盐、乙醇酸盐、粘酸盐、琥珀酸盐、乳酸盐、乳清酸盐、帕莫酸盐、甘氨酸盐、丙氨酸盐、精氨酸盐、肉桂酸盐、苯甲酸盐、苯磺酸盐、对甲苯磺酸盐、乙酸盐、丙酸盐、戊酸盐、三苯基乙酸盐、L-脯氨酸盐、阿魏酸盐、2-羟基乙磺酸盐、扁桃酸盐、硝酸盐、甲磺酸盐、丙二酸盐、龙胆酸盐、水杨酸盐、草酸盐或戊二酸盐：

WO 2022/052950 A1

[见续页]

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, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, 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, 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)。

根据细则4.17的声明：

— 关于申请人有权要求在先申请的优先权(细则4.17(iii))

本国际公布：

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。