(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
2020 年 10 月 29 日 (29.10.2020)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2020/216274 A1

(51) 国际专利分类号:
A61K 31/519 (2006.01) *A61P 31/12* (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2020/086301

(22) 国际申请日: 2020 年 4 月 23 日 (23.04.2020)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201910326899.9 2019年4月23日 (23.04.2019) CN

(71) 申请人: 正大天晴药业集团股份有限公司 (**CHIA TAI TIANQING PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.**) [CN/CN]; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。

(72) 发明人: **景姜辉(JING, Jianghui)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **董丽慧(DONG, Lihui)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **许易(XU, Yi)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **李新路(LI, Xinlu)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **鲁锡峰(LU, Xifeng)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **王尚(WANG, Shang)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **臧海山(ZANG, Haishan)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **李敏(LI, Min)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **陈智林(CHEN, Zhilin)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **赵贤东(ZHAO, Xiandong)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。 **孙鹏(SUN, Peng)**; 中国江苏省连云港市郁州南路369号, Jiangsu 222062 (CN)。

(74) 代理人: 北京永新同创知识产权代理有限公司(**NTD UNIVATION INTELLECTUAL PROPERTY AGENCY LTD.**); 中国北京市东城区北三环东路36号北京环球贸易中心C座10层, Beijing 100013 (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, 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, 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)。

本国际公布:
— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。

WO 2020/216274 A1

(54) **Title:** SOLID PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRISING TLR7 AGONIST

(54) 发明名称: 一种TLR7激动剂的固体药物组合物

(57) **Abstract:** A solid pharmaceutical composition comprising a TLR7 agonist 2-butoxy-7-(4-(pyrrolidin-1-ylmethyl)benzyl)-5H-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-amine, a preparation method therefor, and an medical application thereof. The solid pharmaceutical composition has excellent stability and dissolution properties.

(57) 摘要: 一种TLR7激动剂2-丁氧基-7-(4-(吡咯烷-1-基甲基)苄基)-5H-吡咯并[3,2-d]嘧啶-4-胺的固体药物组合物、其制备方法及其医药用途，所述的固体药物组合物具有优良的稳定性和溶出性质。