

(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 2018/108128 A1

(43) 国际公布日
2018 年 6 月 21 日 (21.06.2018)

(51) 国际专利分类号:

A61K 9/14 (2006.01) *C07D 405/14* (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) *C07D 413/14* (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) *A61P 3/10* (2006.01)

中国上海市浦东区爱迪生路 275 号,
Shanghai 201203 (CN)。

(21) 国际申请号: PCT/CN2017/116209

(22) 国际申请日: 2017 年 12 月 14 日 (14.12.2017)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
201611162346.7 2016 年 12 月 15 日 (15.12.2016) CN

(71) 申请人: 华领医药技术(上海)有限公司
(HUA MEDICINE (SHANGHAI) LTD.) [CN/CN];

(72) 发明人: 陈力(CHEN, Li); 中国上海市松江区新桥镇新车公路 2 号 C-40 室, Shanghai 201612 (CN)。
李永国(LI, Yongguo); 中国上海市徐汇区南丹东路 300 弄 3 号楼 203 室, Shanghai 200030 (CN)。王
高森(WANG, Gaosen); 中国上海市长宁区安顺路 240 弄 10 号 603 室, Shanghai 200051 (CN)。

(74) 代理人: 北京市柳沈律师事务所(LIU, SHEN & ASSOCIATES); 中国北京市海淀区彩和坊路 10 号 1 号楼 10 层, Beijing 100080 (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,

(54) Title: ORAL PREPARATION OF GLUCOKINASE ACTIVATOR AND PREPARATION METHOD THEREFOR

(54) 发明名称: 葡萄糖激酶激活剂的口服制剂及其制备方法

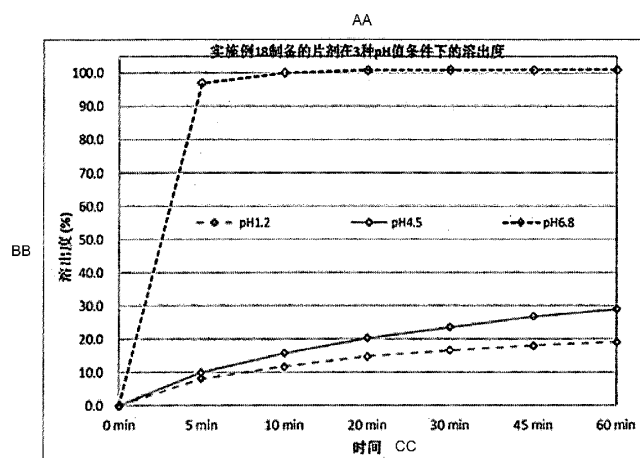


图 6

AA Dissolutions of a tablet prepared in embodiment 18 at three pH values
BB Dissolution
CC Time

(57) Abstract: The present invention relates to a solid dispersion and a preparation method therefor. The solid dispersion contains a glucokinase activator, an isotopic label thereof, or a medicinal salt thereof and a polymer support. The present invention further relates to a solid dispersion composition containing the solid dispersion and an excipient. The present invention also relates to an oral preparation of the glucokinase activator, containing the solid dispersion or the solid dispersion composition. The present invention also relates to a tablet and a capsule of the glucokinase activator and a preparation method therefor. In addition, the present invention also relates to uses of the solid dispersion, the solid dispersion composition and the oral preparations comprising the tablet and the capsule, which can

[见续页]

WO 2018/108128 A1

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, 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, 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))。

be used for treating and/or preventing selected diseases or medical conditions and especially one or more diseases selected from type I diabetes mellitus, type II diabetes mellitus, impaired glucose tolerance, impaired fasting glucose and hyperglycemia.

(57) 摘要: 本发明涉及固体分散体及其制备方法, 其中, 所述固体分散体包含葡萄糖激酶激活剂、其同位素标记物或其可药用盐和聚合物载体。本发明进一步涉及包含所述固体分散体和赋形剂的固体分散体组合物。本发明还涉及葡萄糖激酶激活剂的口服制剂, 其包含所述固体分散体或固体分散体组合物。本发明还进一步涉及葡萄糖激酶激活剂的片剂和胶囊剂及它们的制备方法。另外, 本发明还涉及固体分散体、固体分散体组合物和口服制剂包括片剂和胶囊剂的用途, 其用于治疗 和/或预防所选疾病及医学病症, 尤其一种或多种选自 I 型糖尿病、II 型糖尿病、葡萄糖耐量降低、空腹血糖异常以及高血糖症的疾病。