(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국

(43) 국제공개일
2022 년 10 월 20 일 (20.10.2022)

WIPO | PCT

(10) 국제공개번호
WO 2022/220636 A1

(51) 국제특허분류:
A61K 9/20 (2006.01) *A61K 31/4155* (2006.01)

(21) 국제출원번호: PCT/KR2022/005451

(22) 국제출원일: 2022 년 4 월 15 일 (15.04.2022)

(25) 출원언어: 한국어

(26) 공개언어: 한국어

(30) 우선권정보:
10-2021-0049613 2021 년 4 월 16 일 (16.04.2021) KR

(71) 출원인: 주식회사 엘지화학 **(LG CHEM, LTD.)** [KR/KR]; 07336 서울시 영등포구 여의대로 128, Seoul (KR).

(72) 발명자: **유석철 (YOO, Seok Cheol)**; 34122 대전시 유성구 문지로 188, LG화학 기술연구원, Daejeon (KR). **장주명 (JANG, Joomyung)**; 34122 대전시 유성구 문지로 188, LG화학 기술연구원, Daejeon (KR). **서진아 (SEO, Jin A)**; 34122 대전시 유성구 문지로 188, LG화학 기술연구원, Daejeon (KR). **임도형 (LIM, Dohyung)**; 34122 대전시 유성구 문지로 188, LG화학 기술연구원, Daejeon (KR).

(74) 대리인: **김성호 (KIM, Sung Ho)**; 06221 서울시 강남구 언주로85길 24, 3층(역삼동, PNM 타워)(워너비특허법률사무소), Seoul (KR).

(81) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 권리의 보호를 위하여): 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, JM, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, 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.

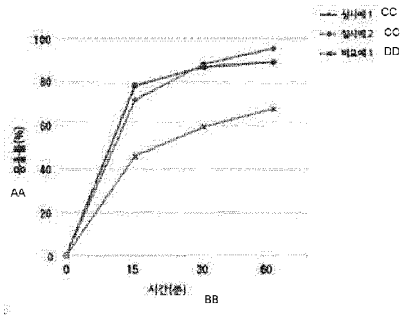
(84) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 역내 권리의 보호를 위하여): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 유라시아 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 유럽 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

공개:
— 국제조사보고서와 함께 (조약 제21조(3))

WO 2022/220636 A1

(54) **Title:** ORAL FORMULATION CONTAINING 1-(3-CYANO-1-ISOPROPYL-INDOL-5-YL)PYRAZOLE-4-CARBOXYLIC ACID

(54) **발명의 명칭:** 1-(3-시아노-1-아이소프로필-인돌-5-일)피라졸-4-카르복실산을 포함하는 경구용 제제



AA .. Dissolution rate (%)
BB .. Time (minute)
CC .. Example 1/2
DD .. Comparative example 1.

(57) **Abstract:** The present invention relates to an oral formulation containing API selected from 1-(3-cyano-1-isopropyl-indol-5-yl)pyrazole-4-carboxylic acid or a pharmaceutically acceptable salt thereof, wherein the particle size D(0.9), which is the maximal particle size for 90% of the particles in cumulative particle size distribution, is 80 μm to 300 μm (both inclusive). Although including a high content of API, the oral formulation according to the present invention exhibits low friability and an increased dissolution rate by controlling the particle size of the API to a specific range.

(57) **요약서:** 본 발명은 입도 누적분포에서 최대 입도에 대해 90%에 해당하는 과립에 대한 입도(D(0.9))가 80 ㎛ 이상 300 ㎛ 이하인 1-(3-시아노-1-아이소프로필-인돌-5-일)피라졸-4-카르복실산 또는 이의 약학적으로 허용가능한 염에서 선택되는 API를 함유하는 경구용 제제에 관한 것이다. 본 발명에 따른 경구용 제제는 API의 입도를 특정 범위로 조절함으로써, 높은 함량의 API를 포함함에도 불구하고, 낮은 마손도 및 증가된 용출률을 가진다.