(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
19. April 2007 (19.04.2007)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2007/042160 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:
A61K 9/20 (2006.01) *A61K 9/00* (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2006/009466

(22) Internationales Anmeldedatum:
29. September 2006 (29.09.2006)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10 2005 048 293.7 8. Oktober 2005 (08.10.2005) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH** [DE/DE]; Brüningstrasse 50, 65929 Frankfurt am Main (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **SOENNICHSEN, Caren** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **WESCH, Roland** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE). **MEIER, Heiko** [DE/DE]; Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*
— *vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen*

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) **Title:** RETARD FORMULATION FOR PRALNACASAN

(54) **Bezeichnung:** RETARDFORMULIERUNG FÜR PRALNACASAN

(57) **Abstract:** The inventive retard tablets comprising at least two layers, wherein at least one layer rapidly releases a drug 1S 9S (RS, 3S) N-(2-Ethoxy-5-oxo- tetrafuran-3-yl)-6, 10-dioxo-9-(isochinolin-1-oyl-amino)-1, 2, 3, 4, 7, 8, 9, 10-octahydro- 6-H-pyridazino [1 , 2-a] [1, 2] diazepin-1-carboxamide and/or the salts or derivatives thereof and/or acids released therefrom and at least one layer releases a drug 1S, 9S (RS, 3S) N-(2-Ethoxy-5-oxo-tetrafuran-3-yl)-6,10- dioxo-9-(isochinolin-1-oyl-amino)-1, 2, 3, 4, 7, 8, 9, 10-octahydro-6-H-pyridazino [1, 2-a] [1, 2] diazepin-1-carboxamide and/or the salts or derivatives thereof and/or acids released therefrom in a delayed manner for treating autoimmune diseases, type I and type II diabetes, rheumatoid arthritis, osteoarthritis and/or psoriasis

(57) **Zusammenfassung:** Retardtablette bestehend aus mindestens zwei Schichten, dadurch gekennzeichnet, dass mindestens eine Schicht das Arzneimittels 1S 9S (RS, 3S) N-(2-Ethoxy-5-oxo- tetrafuran-3-yl)-6, 10-dioxo-9-(isochinolin-1-oyl-amino)-1, 2, 3, 4, 7, 8, 9, 10-octahydro- 6-H-pyridazino [1 , 2-a] [1, 2] diazepin-1-carboxamide und/oder dessen Salze oder Derivate und/oder die freien Säuren davon, schnell abgibt und mindestens eine Schicht das Arzneimittels 1S, 9S (RS, 3S) N-(2-Ethoxy-5-oxo-tetrafuran-3-yl)-6,10- dioxo-9-(isochinolin-1-oyl-amino)-1, 2, 3, 4, 7, 8, 9, 10-octahydro-6-H-pyridazino [1, 2-a] [1, 2] diazepin-1-carboxamide und/oder dessen Salze oder Derivate und/oder die freien Säuren davon retardiert abgibt zur Behandlung von Autoimmunkrankheiten, Diabetes Typ I und Typ II, rheumatoider Arthritis, Osteoarthritis, und/oder Psoriasis.

WO 2007/042160 A1