(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2022年12月15日(15.12.2022)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2022/260064 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/506 (2006.01)　*A61K 47/20* (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01)　*A61K 47/26* (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)　*A61K 47/32* (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)　*A61K 47/34* (2017.01)
A61K 9/48 (2006.01)　*A61K 47/36* (2006.01)
A61K 47/04 (2006.01)　*A61K 47/38* (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)　*A61P 3/00* (2006.01)
A61K 47/14 (2006.01)　*A61P 43/00* (2006.01)

(21) 国際出願番号：　PCT/JP2022/023076

(22) 国際出願日：　2022年6月8日(08.06.2022)

(25) 国際出願の言語：　日本語

(26) 国際公開の言語：　日本語

(30) 優先権データ：
特願 2021-096206　2021年6月8日(08.06.2021)　JP

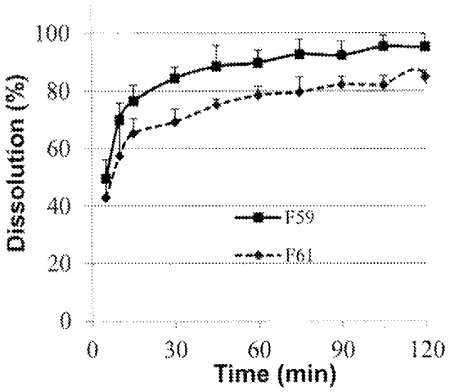
(71) 出願人：中外製薬株式会社(**CHUGAI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA**) [JP/JP]；〒1158543 東京都北区浮間５丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者：酒井 憲一(**SAKAI, Kenichi**)；〒1158543 東京都北区浮間５丁目５番１号 中外製薬株式会社内 Tokyo (JP). 内山 博雅(**UCHIYAMA, Hiromasa**)；〒1158543 東京都北区浮間５丁目５番１号 中外製薬株式会社内 Tokyo (JP). 蓑田 知幸(**MINODA, Tomoyuki**)；〒1158543 東京都北区浮間５丁目５番１号 中外製薬株式会社内 Tokyo (JP). 吉川 真由美(**YOSHIKAWA, Mayumi**)；〒1158543 東京都北区浮間５丁目５番１号 中外製薬株式

(54) **Title:** PREPARATION CONTAINING DIHYDROPYRIDAZINE-3,5-DIONE DERIVATIVE

(54) 発明の名称： ジヒドロピリダジン－３，５－ジオン誘導体を含有する製剤

［図1］



(57) **Abstract:** The present invention provides: a pharmaceutical composition having excellent elution properties and uniform content, provided by mixing a p-toluenesulfonate of 7-[[2,3-difluoro-4-[2-[2-methoxyethyl(methyl)amino]ethoxy]phenyl]methyl]-10-hydroxy-6-methyl-8-oxo-N-[4-(trifuluromethyl)-2-[6-(trifluoromethyl)pyrimidin-4-yl]phenyl]-6,7-diazaspiro[4,5]deca-9-ene-9-carboxamide with a specific additive to prepare a pharmaceutical preparation; and a method for producing the pharmaceutical composition.

(57) 要約：本発明により、７－［［２，３－ジフルオロ－４－［２－［２－メトキシエチル（メチル）アミノ］エトキシ］フェニル］メチル］－１０－ヒドロキシ－６－メチル－８－オキソ－Ｎ－［４－（トリフルオロメチル）－２－［６－（トリフルオロメチル）ピリミジン－４－イル］フェニル］－６，７－ジアザスピロ［４，５］デカ－９－エン－９－カルボキサミドのｐ－トルエンスルホン酸塩を、特定の添加剤と混合して製剤化をすることにより、溶出性が優れ、かつ含量が均一な医薬組成物とその製造方法が提供される。

WO 2022/260064 A1

［続葉有］

会社内 Tokyo (JP). 夏本 盛森(**NATSUMOTO, Shigemori**); 〒1158543 東京都北区浮間５丁目５番１号 中外製薬株式会社内 Tokyo (JP). ▲高▼野 隆介(**TAKANO, Ryusuke**); 〒4128513 静岡県御殿場市駒門１丁目１３５番地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP).

(74) 代理人: 山本 修, 外 (**YAMAMOTO, Osamu** et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町二丁目２番１号 新大手町ビル２０６区 ユアサハラ法律特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): 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, IQ, IR, IS, IT, JM, 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(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (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).

規則4.17に規定する申立て：
一 出願し及び特許を与えられる出願人の資格に関する申立て（規則4.17(ii)）

添付公開書類：
一 国際調査報告（条約第21条(3)）