(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 12 月 3 日 (03.12.2020)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号
WO 2020/239097 A1

(51) 国际专利分类号:
A61K 9/20 (2006.01) *A61K 31/55* (2006.01)
A61K 9/50 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2020/093438

(22) 国际申请日: 2020 年 5 月 29 日 (29.05.2020)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
PCT/CN2019/089618
2019年5月31日 (31.05.2019) CN

(71) 申请人: 百济神州有限公司(BEIGENE, LTD.); 开曼群岛大开曼, Grand Cayman KY1-1108 (KY)。

(72) 发明人; 及

(71) 申请人 (仅对*SC*): 郭远静 (GUO, Yuanjing) [CN/CN]; 中国北京市昌平区中关村生命科学园科学园路30号, Beijing 102206 (CN)。

(72) 发明人: 王亦平 (WANG, Yiping); 中国北京市昌平区中关村生命科学园科学园路30号, Beijing 102206 (CN)。 范文源 (FAN, Wenyuan); 中国江苏省苏州市苏州工业园区桑田街218号生物产业园9栋, Jiangsu 215007 (CN)。 杜争鸣 (DU, Zhengming); 中国江苏省苏州市苏州工业园区桑田街218号生物产业园9栋, Jiangsu 215007 (CN)。 仇罡 (QIU, Gang); 中国江苏省苏州市苏州工业园区桑田街218号生物产业园9栋, Jiangsu 215007 (CN)。 徐铄 (XU, Shuo); 中国江苏省苏州市苏州工业园区桑田街218号生物产业园9栋, Jiangsu 215007 (CN)。 吕会茹 (LV, Huiru); 中国江苏省苏州市苏州工业园区桑田街218号生物产业园9栋, Jiangsu 215007 (CN)。

(74) 代理人: 北京坤瑞律师事务所 (WU, FENG & ZHANG); 中国北京市海淀区丰秀中路3号院2号楼3层, Beijing 100094 (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))。

(54) **Title:** PARP INHIBITOR PELLET PREPARATION AND PREPARATION PROCESS THEREFOR

(54) 发明名称: 一种PARP抑制剂微丸制剂及其制备工艺

(57) **Abstract:** Disclosed is a PARP inhibitor pellet composition and a preparation process therefor. The pellet composition contains a pellet and, optionally, an additional excipient, wherein the pellet contains (1) a pellet pill core, (2) a drug-containing layer and (3) optionally, a protective layer; the drug-containing layer contains (a) an active ingredient and (b) an adhesive; when the composition contains the protective layer, the protective layer contains (c) a coating material; and the active ingredient is (R)-2-fluoro-10a-methyl-7,8,9,10,10a,11-hexahydro-5,6,7a,11-tetra-azacycloheptatrieno[def]cyclopentadieno[a]fluoren-4(5H)-one, a pharmaceutically acceptable salt and a hydrate thereof.

(57) 摘要: 一种PARP抑制剂微丸组合物及其制备工艺, 所述微丸组合物包含: 微丸和任选地的外加赋形剂, 所述的微丸包含(1)微丸丸芯; (2)含药层以及(3)任选地保护层; 含药层包含(a)活性成分和(b)粘合剂; 当所述组合物包含保护层时, 所述的保护层包含(c)包衣材料; 所述的活性成分为(R)-2-氟-10a-甲基-7,8,9,10,10a,11-六氢-5,6,7a,11-四氮杂环庚三烯并[def]环戊二烯并[a]芴-4(5H)-酮、其药物上可接受的盐及其水合物。

WO 2020/239097 A1