

(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 2021/208976 A1

(43) 国际公布日
2021 年 10 月 21 日 (21.10.2021)

(51) 国际专利分类号:

A61K 9/14 (2006.01) A61P 25/30 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01) A61P 25/20 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01) A61P 25/22 (2006.01)
A61K 31/46 (2006.01) A61P 11/00 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2021/087262

(22) 国际申请日: 2021 年 4 月 14 日 (14.04.2021)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:

202010304917.6 2020 年 4 月 17 日 (17.04.2020) CN
202011594757.X 2020 年 12 月 29 日 (29.12.2020) CN

(71) 申请人: 上海海雁医药科技有限公司 (SHANGHAI HAIYAN PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY CO., LTD.) [CN/CN]; 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。 扬子江药业集团有限公司 (YANGTZE RIVER PHARMACEUTICAL GROUP CO., LTD.) [CN/CN]; 中国江苏省泰州市高港区扬子江南路 1 号, Jiangsu 225321 (CN)。

(72) 发明人: 江涛涛 (JIANG, Taotao); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。 王吉标 (WANG, Jibiao); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。 杨茜 (YANG, Han); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。 李利 (LI, Li); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。 但招陵 (DAN, Zhaoling); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai

201203 (CN)。 朱科屹 (ZHU, Keyi); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。 曾振亚 (ZENG, Zhenya); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。 苏波 (SU, Bo); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。 陈曦 (CHEN, Xi); 中国上海市浦东新区中国 (上海) 自由贸易试验区李冰路 67 弄 8 号, Shanghai 201203 (CN)。

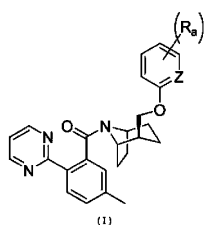
(74) 代理人: 广州华进联合专利商标代理有限公司 (ADVANCE CHINA IP LAW OFFICE); 中国广东省广州市天河区珠江东路 6 号 4501 房 (部位: 自编 01-03 和 08-12 单元) (仅限办公用途), Guangdong 510623 (CN)。

(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, IT, 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)。

(54) Title: SOLID PHARMACEUTICAL PREPARATION, PREPARATION METHOD THEREFOR AND USE THEREOF

(54) 发明名称: 固体药物制剂及其制备方法和用途



(57) Abstract: The present invention relates to a solid pharmaceutical preparation and a preparation method therefor. Specifically, disclosed are a solid pharmaceutical preparation that comprises an orexin receptor antagonist compound and a preparation method therefor, the solid pharmaceutical preparation comprising an active ingredient of a compound represented by formula I, a filler, a binder, a disintegrant, and a lubricant. The solid pharmaceutical preparation has good dissolution, stability and in vivo bioavailability.

(57) 摘要: 本发明涉及一种固体药物制剂及其制备方法, 具体地, 公开了一种包含食欲素受体拮抗剂化合物的固体药物制剂及其制备方法, 所述固体药物制剂包含活性成分式 I 化合物、填充剂、粘合剂、崩解剂、润滑剂。该固体药物制剂具有良好的溶出度、稳定性以及体内生物利用度。

[见续页]

本国际公布：

— 包括国际检索报告(条约第21条(3))。