(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
2002 年12 月27 日 (27.12.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/102383 A1

(51) 国際特許分類[7]: A61K 31/4709, 9/08, 47/32, 47/36, 47/40, A61P 1/04, 7/02, 9/00, 9/10, 9/12, 11/06, 29/00, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/05705

(22) 国際出願日: 2002 年6 月7 日 (07.06.2002)

(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2001-179239 2001 年6 月13 日 (13.06.2001) JP
特願2002-127065 2002 年4 月26 日 (26.04.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社大塚製薬工場 (OTSUKA PHARMACEUTICAL FACTORY, INC.) [JP/JP]; 〒772-8601 徳島県 鳴門市 撫養町立岩字芥原１１５ Tokushima (JP). 大塚製薬株式会社 (OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒101-8535 東京都 千代田区 神田司町２丁目９番地 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 井上 冨士夫 (INOUE,Fujio) [JP/JP]; 〒772-0041 徳島県 鳴門市 大津町大代２４０番地の４１ Tokushima (JP). 河上 啓一 (KAWAKAMI,Keiichi) [JP/JP]; 〒771-0204 徳島県 板野郡 北島町鯛浜字西ノ須１５の２１ Tokushima (JP). 永康 新也 (NAGAYASU,Shinya) [JP/JP]; 〒770-0802 徳島県 徳島市 吉野本町２丁目１１ Tokushima (JP). 岡本 英志 (OKAMOTO,Hideshi) [JP/JP]; 〒771-1155 徳島県 徳島市 応神町西貞方字中園９４－１ Tokushima (JP).

(74) 代理人: 岩谷 龍 (IWATANI,Ryo); 〒530-0003 大阪府 大阪市 北区堂島２丁目１番２７号 桜橋千代田ビル５階 Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CN, CO, CR, CU, CZ, DM, DZ, EC, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, OM, PH, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TM, TN, TT, UA, US, UZ, VN, YU, ZA.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

規則4.17に規定する申立て:
— *AE, AG, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CN, CO, CR, CU, CZ, DM, DZ, EC, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MA, MD,*

*[続葉有]*

(54) **Title:** AQUEOUS CILOSTAZOL PREPARATION FOR INJECTION

(54) **発明の名称:** 注射用シロスタゾール水性製剤

(57) **Abstract:** An aqueous preparation for injections which contains cilostazol or a pharmacologically acceptable salt thereof as the active ingredient and further contains a cyclodextrin. Due to the cyclodextrin, the solubility of the cilostazol or salt in the water is heightened. As a result, the aqueous preparation in the solution state has improved long-term stability.

(57) **要約:**

本発明は、シロスタゾールまたはその薬理学的に許容され得る塩が有効成分として含有されている注射用シロスタゾール水性製剤に、更にシクロデキストリン類が含有させることにより、シロスタゾールまたはその薬理学的に許容され得る塩の水への溶解度を上げることができ、その結果として、溶液状態での経時的な安定性が向上されたシロスタゾールまたはその薬理学的に許容され得る塩を含有する注射用水性製剤を提供することができる。

WO 02/102383 A1

*MG, MK, MN, MX, NO, NZ, OM, PH, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TM, TN, TT, UA, UZ, VN, YU, ZA, ARIPO* 特許 *(GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),* ユーラシア特許 *(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),* ヨーロッパ特許 *(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI* 特許 *(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)*の指定のための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))*

— すべての指定国のための先の出願に基づく優先権を主張する出願人の資格に関する申立て*(*規則*4.17(iii))*

— *US*のみのための発明者である旨の申立て *(*規則*4.17(iv))*

添付公開書類:

— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。