

(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



PCT



(10) 国际公布号

WO 2011/038683 A1

(43) 国际公布日
2011 年 4 月 7 日 (07.04.2011)

- (51) 国际专利分类号:
A61K 9/20 (2006.01) *A61P 9/00* (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)
- (21) 国际申请号: PCT/CN2010/077466
- (22) 国际申请日: 2010 年 9 月 29 日 (29.09.2010)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (30) 优先权:
61/246,804 2009 年 9 月 29 日 (29.09.2009) US
- (71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): 台湾东洋药品工业股份有限公司 (TTY BIOPHARM COMPANY LIMITED) [CN/CN]; 中国台湾省台北市市民权东路三段 170 号 4 楼, Taiwan (CN)。 因华生技制药股份有限公司 (INNOPHARMAX, INC.) [CN/CN]; 中国台湾省台北市内湖区瑞光路 478 巷 22 号 9 楼, Taiwan (CN)。
- (72) 发明人; 及
- (75) 发明人/申请人 (仅对美国): 郝为华 (HAO, Wei-Hua) [CN/CN]; 中国台湾省台北市内湖区瑞光路 478 巷 22 号 9 楼, Taiwan (CN)。 林宗忻 (LIN, Tsung-Hsin) [CN/CN]; 中国台湾省台北市内湖区瑞

光路 478 巷 22 号 9 楼, Taiwan (CN)。 吕大千 (LV, Ta-Chien) [CN/CN]; 中国台湾省台北市内湖区瑞光路 478 巷 22 号 9 楼, Taiwan (CN)。

(74) 代理人: 北京三友知识产权代理有限公司 (BEIJING SANYOU INTELLECTUAL PROPERTY AGENCY LTD.); 中国北京市金融街 35 号国际企业大厦 A 座 16 层, Beijing 100033 (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, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, 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,

[见续页]

(54) Title: CONTROLLED RELEASE FORMULATION OF CARVEDILOL

(54) 发明名称: 卡维地洛控释剂

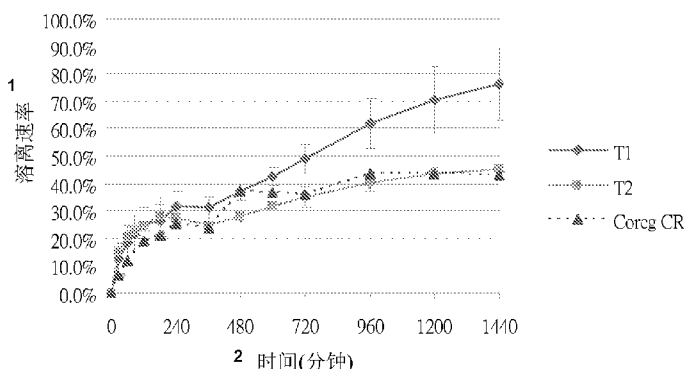


图 8/ Fig.8

1 dissolution rate
2 time(min)

(57) Abstract: A controlled release formulation useful in the treatment and/or prevention of cardiac diseases is disclosed. The formulation comprises a therapeutically effective amount of carvedilol or its pharmaceutically acceptable salt, matrix-forming polymer, solubility enhancer and excipients. The matrix-forming polymer comprises one or more selected from 20-60%wt of Methocel K15M, 15-20%wt of Methocel K100M, 25-35%wt of Methocel E4M, 35-45%wt of Eudragit RSPO or 35-55%wt of WSR N12NF. The solubility enhancer comprises one or more selected from 25-55%wt of povidone, 25-35%wt of PEG6000 or 35-45%wt of HPC-L. The excipient comprises one or more selected from 15-35%wt of corn starch or 0.1-2%wt of magnesium stearate. In an embodiment, the formulation includes two or more sub units having with release profiles.

[见续页]

WO 2011/038683 A1



PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, 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))。

(57) 摘要:

公开了一种用于治疗 and/或预防心血管疾病控释剂型。该控释剂包含治疗有效量的卡维地洛或其医药可接受盐、基质形成聚合物、溶解度增强剂、以及赋形剂。该基质形成聚合物包含以下一种或多种: 20-60 重量%的美多秀 K15M, 15-20 重量%的美多秀 K100M, 25-35 重量%的美多秀 E4M, 35-45 重量%的尤特奇 RSPO、或 35-55 重量%WSR N12NF。该溶解度增强剂包含以下一种或多种: 25-55 重量%的聚维酮、25-35 重量%的聚乙二醇 6000、或 35-45 重量%的羟丙基纤维素-L。该赋形剂包含以下一种或多种: 15-35 重量%的玉米淀粉或 0.1-2 重量%的硬脂酸镁。在一实施例中, 该制剂包含了二个或更多个具有不同释放曲线的次单元。