(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

(43) Date de la publication internationale
16 octobre 2003 (16.10.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 03/084517 A2

(51) Classification internationale des brevets[7] : A61K 9/50

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR03/01095

(22) Date de dépôt international : 7 avril 2003 (07.04.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/04409 9 avril 2002 (09.04.2002) FR
02/10846 2 septembre 2002 (02.09.2002) FR

(71) Déposant *(pour tous les États désignés sauf US)* : **FLAMEL TECHNOLOGIES** [FR/FR]; 33, avenue du Docteur Georges Lévy, F-69200 Venissieux (FR).

(72) Inventeurs; et
(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : **CASTAN, Catherine** [FR/FR]; "Le Verger du Gontey", 55, chemin du May, F-69530 Olienas (FR). **GUIMBERTEAU, Florence** [FR/FR]; 3, route de la Garenne, F-33450 Montussan (FR). **MEYRUEIX, Rémi** [FR/FR]; 42, rue Hector Berlioz, "Le Bois St Rambert", F-69009 Lyon (FR).

(74) Mandataires : **FLEURANCE, Raphaël** etc.; Cabinet Plasseraud, 84, rue d'Amsterdam, F-75440 Paris Cedex 09 (FR).

(81) États désignés *(national)* : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés *(régional)* : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :
— *sans rapport de recherche internationale, sera republiée dès réception de ce rapport*

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) **Title:** ORAL PHARMACEUTICAL FORMULATION IN THE FORM OF AQUEOUS SUSPENSION OF MICROCAPSULES FOR MODIFIED RELEASE OF AMOXICILLIN

(54) **Titre :** FORMULATION PHARMACEUTIQUE ORALE SOUS FORME DE SUSPENSION AQUEUSE DE MICROCAPSULES PERMETTANT LA LIBERATION MODIFIEE D'AMOXICILLINE

(57) **Abstract:** The invention concerns liquid pharmaceutical formulations, for oral delivery, with modified release of amoxicillin and consisting of suspensions of coated particles of amoxicillin (microcapsules). The microcapsules constituting the dispersed phase of the suspension are designed, according to the invention, to enable modified release of amoxicillin, in accordance with a profile which remains unaltered during the shelf life of the liquid suspension. Therefor, the invention consists in selecting a coating composition specific to the microcapsules consisting of at least four components enabling preservation of said microcapsules in water without altering their properties of modified release of amoxicillin, said liquid phase being furthermore saturated with amoxicillin.

(57) **Abrégé :** L'invention concerne des formulations pharmaceutiques liquides, administrables oralement, à libération modifiée d'amoxicilline et constituées par des suspensions de particules d'amoxicilline enrobées (microcapsules). Les microcapsules constituant la phase dispersée de la suspension sont conçues, conformément à l'invention, pour permettre la libération modifiée de l'amoxicilline, selon un profil n'évoluant pas au cours du stockage de la suspension liquide. Pour ce faire, les inventeurs proposent de sélectionner une composition d'enrobage spécifique pour les microcapsules constituée d'au moins quatre composants permettant de conserver ces microcapsules dans l'eau sans modifier leurs propriétés de libération modifiée de l'amoxicilline, cette phase liquide étant par ailleurs saturée en amoxicilline.

WO 03/084517 A2