

(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:  
2004年3月4日(04.03.2004)

PCT

(10) 国际公布号:  
WO 2004/018444 A1

- (51) 国际分类号<sup>7</sup>: C07D 307/88, A61K 31/343
- (21) 国际申请号: PCT/CN2002/000579
- (22) 国际申请日: 2002年8月21日(21.08.2002)
- (25) 申请语言: 中文
- (26) 公布语言: 中文
- (71) 申请人(对除美国以外的所有指定国): 中奇制药技术(石家庄)有限公司(ZHONGQI PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY (SHIJIAZHUANG) CO., LTD.) [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。
- (72) 发明人;及
- (75) 发明人/申请人(仅对美国): 牛占旗(NIU, Zhan-qi) [CN/CN]; 赵凯(ZHAO, Kai) [CN/CN]; 刘文娟(LIU, Wen-juan) [CN/CN]; 周桂荣(ZHOU, Gui-rong) [CN/CN]; 刘超(LIU, Chao) [CN/CN]; 王荣端(WANG, Rong-duan) [CN/CN]; 苑洪忠(YUAN, Hong-zhong) [CN/CN]; 郭文敏(GUO, Wen-min) [CN/CN]; 闫随朝(YAN, Sui-chao) [CN/CN]; 白敏(BAI, Min) [CN/CN]; 中国河北省石家庄市中山西路276号, Hebei 050051 (CN)。

- (74) 代理人: 永新专利商标代理有限公司北京办事处(NTD PATENT & TRADEMARK AGENCY LTD., BEIJING OFFICE); 中国北京市金融大街27号投资广场A座10层, Beijing 100032 (CN)。
- (81) 指定国(国家): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, 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, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW
- (84) 指定国(地区): ARIPO专利(GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚专利(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲专利(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI专利(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。

所引用双字母代码和其它缩写符号, 请参考刊登在每期PCT公报期刊起始的“代码及缩写符号简要说明”。

(54) Title: CLATHRATES OF BUTYLPHTHALIDE WITH CYCLODEXTRIN OR ITS DERIVATIVES, A PROCESS FOR THEIR PREPARATIONS AND THE USE THERE OF

(54) 发明名称: 丁苯酞环糊精或环糊精衍生物包合物及其制备方法和用途

(57) Abstract: The present invention relates to the clathrates of butylphthalide, which is D,L-mixed or levorotatory, with cyclodextrin or its derivatives, a process for their preparations and the use thereof. In the invention, the butylphthalide is included with cyclodextrin or its derivatives, preferred hydroxypropyl- $\beta$ -cyclodextrin, in order to improve the water-solubility of butylphthalide, develop clinical solid or liquid formulation and so that the curing effect of butylphthalide can exhibit better. The clathrate, in which the mole ratio of butylphthalide and cyclodextrin or derivatives thereof is 1:1-10, can be used in preparing transfusion, injection, injectable powder, orally liquid, syrup, tablets, granules, dispersible tablets and others.

(57) 摘要

本发明涉及丁苯酞环糊精或环糊精衍生物包合物及其制备方法和用途, 本发明所述丁苯酞是指混旋丁苯酞和左旋丁苯酞。为提高丁苯酞的水溶性, 开发临床所需的固体剂型、液体剂型, 以便更好地发挥丁苯酞的治疗作用, 本发明应用环糊精或环糊精衍生物对丁苯酞进行包合, 该包合物含丁苯酞和环糊精或环糊精衍生物, 二者的分子摩尔比为 1: 1-10, 环糊精或环糊精衍生物优选羟丙基- $\beta$ -环糊精。该包合物可用于制备输液、水针、粉针、口服液、糖浆剂、片剂、胶囊、颗粒剂、分散片等多种剂型。