(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

改訂版

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2005 年1 月6 日 (06.01.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/000312 A1

(51) 国際特許分類[7]: A61K 31/522, 9/14, 47/14, 47/22, 47/38

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/008824

(22) 国際出願日: 2004 年6 月17 日 (17.06.2004)

(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2003-184040 2003 年6 月27 日 (27.06.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大塚製薬株式会社 (OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1018535 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): 友平 裕三 (TOMOHIRA, Yuso) [JP/JP]; 〒7710182 徳島県徳島市川内町平石夷野２２４－１８ 大塚製薬株式会社 製剤研究所内 Tokushima (JP).

(74) 代理人: 三枝 英二, 外(SAEGUSA, Eiji et al.); 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町１－７－１ 北浜ＴＮＫビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, 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, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

(88) 改訂された国際調査報告書の公開日: 2005 年2 月24 日

(15) 訂正情報:
PCTガゼット セクションIIの No.08/2005 (2005 年2 月24 日)を参照

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。

(54) Title: SUSTAINED DRUG-RELASE PARTICLES AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME

(54) 発明の名称: 薬物徐放性粒子及びその製法

(57) Abstract: It is intended to provide sustained theophylline-release particles that are sustained theophylline-release particles comprising a polyglycerol fatty acid ester as a matrix base, having a uniform cored particle structure, being able to effectively masking the unpleasant taste of the drug and having excellent properties of controlling the release (elution) of the drug and a high storage stability. More specifically speaking, a process for producing sustained theophylline-release particles characterized by comprising heating a matrix base containing a polyglycerol fatty acid ester, theophylline and ethyl cellulose to give a liquid mixture, spray-cooling the liquid mixture to give spherical cored particles having an average particle size of 250 μm or less and then melt-coating the cored particles with a fine powder, etc.

(57) 要約: 本発明は、ポリグリセリン脂肪酸エステルをマトリックス基剤としたテオフィリン徐放性粒子であって、均質な核粒子構造を有し、効果的に薬物の不快な味をマスキングすることができ、優れた薬物の放出（溶出）制御性及び優れた保存安定性を有するテオフィリン徐放性粒子を提供する。具体的には、ポリグリセリン脂肪酸エステルを含むマトリックス基剤、テオフィリン及びエチルセルロースを加熱して液状混合物とし、該液状混合物を噴霧冷却して平均粒子径２５０μｍ以下の球形の核粒子とし、該核粒子に微粉末を溶融コーティングすることを特徴とするテオフィリン徐放性粒子の製法等を提供する。

WO 2005/000312 A1