(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
2012 年 1 月 12 日(12.01.2012)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2012/005365 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/426 (2006.01) *A61K 47/10* (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01) *A61K 47/32* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2011/065721

(22) 国際出願日: 2011 年 7 月 8 日(08.07.2011)

(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 2010-156874 2010 年 7 月 9 日(09.07.2010) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 帝人ファーマ株式会社 (TEIJIN PHARMA LIMITED) [JP/JP]; 〒1000013 東京都千代田区霞が関三丁目２番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中村 一裕 (NAKAMURA, Kazuhiro) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町２番１号 帝人ファーマ株式会社 岩国研究センター内 Yamaguchi (JP). 小川 哲平 (OGAWA, Teppei) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町２番１号 帝人ファーマ株式会社 岩国研究センター内 Yamaguchi (JP). 芥川 知也 (AKUTAGAWA, Tomoya) [JP/JP]; 〒7400014 山口県岩国市日の出町２番１号 帝人ファーマ株式会社 岩国研究センター内 Yamaguchi (JP).

(74) 代理人: 青木 篤, 外 (AOKI, Atsushi et al.); 〒1058423 東京都港区虎ノ門三丁目５番１号 虎ノ門３７森ビル青和特許法律事務所 Tokyo (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, 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 (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, LR, 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 (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, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, 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（条約第 21 条(3)）

WO 2012/005365 A1

(54) **Title**: PARTICLE COATING PREPARATION

(54) 発明の名称 : 微粒子コーティング製剤

(57) **Abstract**: Disclosed is a preparation which, in an orally fast-disintegrating tablet having as an active ingredient 2-(3-cyano-4-isobutyloxyphenyl)-4-methyl-5-thiazole carboxylic acid, causes basically no irritation in the mouth or throat, retains good dissolvability and oral disintegration even when stored under high temperature or high humidity conditions. The disclosed orally fast-disintegrating tablet is formed to contain particles comprising nuclear particles which contain 2-(3-cyano-4-isobutyloxyphenyl)-4-methyl-5-thiazole carboxylic acid, which are covered by a layer containing a methacrylic acid copolymer, and which are further coated with an outer layer containing water-soluble sugars, such that after two weeks of storage under conditions with the cap open at 40C / 75% RH, a dissolution test performed according to the Japanese Pharmacopoeia Paddle Method at 50 revolutions per minute (test solution: pH6.0McIlvaine buffer) evaluates the dissolution rate of the 2-(3-cyano-4-isobutyloxyphenyl)-4-methyl-5-thiazole carboxylic acid at 70% or greater after 10 minutes.

(57) 要約: ２－（３－シアノ－４－イソブチルオキシフェニル）－４－メチル－５－チアゾールカルボン酸を有効成分とする口腔内速崩性錠剤において、口腔内や咽頭での刺激感を実質的に感じず、かつ高温・高湿度条件下での保存によっても良好な溶出性や口腔内崩壊性が維持される製剤を提供する。 ２－（３－シアノ－４－イソブチルオキシフェニル）－４－メチル－５－チアゾールカルボン酸を含む核粒子がメタクリル酸コポリマーを含む層で被覆され、さらに４０℃／７５％ＲＨ開栓条件下で２週間保存後の日局パドル法毎分５０回転（試験液：ｐＨ６．０ＭｃＩｌｖａｉｎｅ緩衝液）で評価した溶出試験における１０分後の２－（３－シアノ－４－イソブチルオキシフェニル）－４－メチル－５－チアゾールカルボン酸の溶出率が７０％以上である水溶性糖類を含む層でオーバーコートされた粒子を含んでなる口腔内速崩性錠剤。