(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
2006 年7 月6 日 (06.07.2006)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/070781 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 47/32 (2006.01) *A61K 31/445* (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01) *A61K 47/10* (2006.01)
A61K 9/22 (2006.01) *A61K 47/26* (2006.01)
A61K 9/54 (2006.01) *A61K 47/38* (2006.01)
A61K 31/13 (2006.01) *A61P 25/28* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/023853

(22) 国際出願日: 2005 年12 月27 日 (27.12.2005)

(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 2004-376770 2004 年12 月27 日 (27.12.2004) JP
特願2005-110404 2005 年4 月6 日 (06.04.2005) JP
特願2005-132338 2005 年4 月28 日 (28.04.2005) JP
60/675482 2005 年4 月28 日 (28.04.2005) US

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ株式会社 (EISAI CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川４－６－１０ Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 植木 洋祐 (UEKI, Yosuke) [JP/JP]; 〒5016195 岐阜県各務原市川島竹早町１番地 エーザイ株式会社 川島工園内 Gifu (JP). 藤岡 賢 (FUJIOKA, Satoshi) [JP/JP]; 〒5016195 岐阜県各務原市川島竹早町１番地 エーザイ株式会社 川島工園内 Gifu (JP).

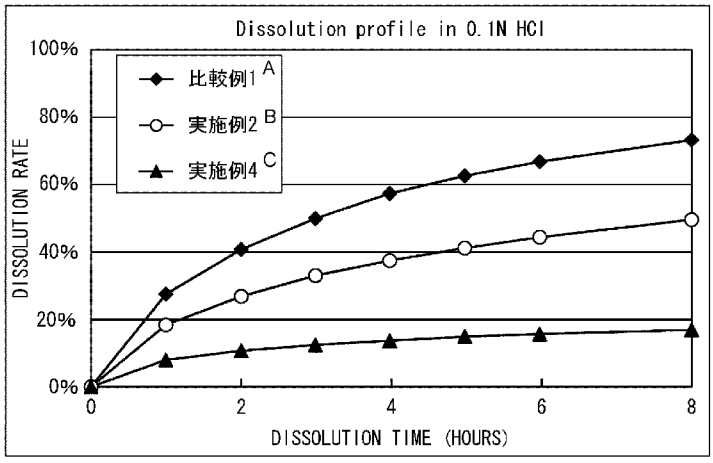
(74) 代理人: 稲葉 良幸, 外(INABA, Yoshiyuki et al.); 〒1066123 東京都港区六本木６－１０－１ 六本木ヒルズ森タワー２３階 ＴＭＩ総合法律事務所 Tokyo (JP).

(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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,

[続葉有]

(54) Title: MATRIX-TYPE CONTROLLED RELEASE PREPARATION COMPRISING BASIC SUBSTANCE OR SALT THEREOF, AND PROCESS FOR PRODUCTION OF THE SAME

(54) 発明の名称: 塩基性薬物又はその塩を含有するマトリックス型徐放性製剤およびその製造方法



A.. COMPARATIVE EXAMPLE 1
B.. EXAMPLE 2
C.. EXAMPLE 4

(57) Abstract: Disclosed are a matrix-type controlled release preparation characterized in that, in the dissolution test, it is possible to ensure the pH-dependent low dissolution of a basic substance or a salt thereof contained in the preparation in the initial stage of the dissolution, and that the ratio between the dissolution rate of the basic substance or salt thereof in an acidic test solution and that in a neutral test solution (dissolution rate in acidic test solution/dissolution rate in neutral test solution) is decreased over time in the late stage of the dissolution compared with that in the initial stage of the dissolution; and a process for producing the preparation. The preparation comprises a basic substance or a salt thereof of which solubilities in a 0.1N aqueous hydrochloric acid solution and a neutral aqueous solution of pH 6.0 are higher than that in a basic aqueous solution of pH 8.0 in combination with at least one enteric polymer.

(57) 要約: 溶出試験において、溶出初期における塩基性薬物又はその塩のpH依存性の小さい溶出の確保が可能であり、且つ、溶出試験の経時的進行に伴い、酸性試験液中での塩基性薬物又はその塩の溶出率

[続葉有]

WO 2006/070781 A1

DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, 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, IS, IT, LT, LU, LV, 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
— 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領 の際には再公開される.

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。

と中性試験液中での塩基性薬物又はその塩の溶出率の比（酸性試験液中での溶出率／中性試験液中での溶出率）が、溶出初期に比較して溶出後期に経時的に低減するマトリックス型徐放性製剤並びにその製造方法を提供する。本発明によれば、０．１Ｎ　塩酸水溶液及びpH６．０の中性水溶液における溶解度が、pH８．０の塩基性水溶液における溶解度よりも高い塩基性薬物又はその塩及び、少なくとも１種類の腸溶性高分子を含有してなる、前記塩基性薬物又はその塩のマトリックス型徐放性製剤である。