(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국

(43) 국제공개일
2013 년 1 월 17 일 (17.01.2013)

WIPO | PCT

(10) 국제공개번호
WO 2013/008981 A1

(51) 국제특허분류:
A61K 9/16 (2006.01) *C07D 495/04* (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01) *A61K 31/4365* (2006.01)

(21) 국제출원번호: PCT/KR2011/008071

(22) 국제출원일: 2011 년 10 월 27 일 (27.10.2011)

(25) 출원언어: 한국어

(26) 공개언어: 한국어

(30) 우선권정보:
10-2011-0069039 2011 년 7 월 12 일 (12.07.2011) KR

(71) 출원인 (US 을(를) 제외한 모든 지정국에 대하여): **삼진제약 주식회사 (SAMJIN PHARMACEUTICAL CO., LTD.)** [KR/KR]; 121-836 서울시 마포구서교동 338-8, Seoul (KR). **(주)에이에스텍 (ASTECH. CO., LTD.)** [KR/KR]; 441-813 경기도 수원시 권선구 고색동 958 첨단벤처밸리 508 호, Gyeonggi-do (KR).

(72) 발명자; 겸
(75) 발명자/출원인 (US 에 한하여): **조의환 (CHO, Eui Hwan)**; 140-030 서울시 용산구 이촌동 430 엘지한강자이아파트 110-701, Seoul (KR). **신희종 (SHIN, Hee Jong)**; 420-761 경기도 부천시 원미구 중2 동 연화마을아파트 1404-101, Gyeonggi-do (KR). **송우헌 (SONG, Woo Heon)**; 441-704 경기도 수원시 권선구 금곡동 LG 빌리지 307-704, Gyeonggi-do (KR). **이순환 (LEE, Sun Hwan)**; 445-788 경기도 화성시 능동 푸른마을포스코더샵아파트 905-3101, Gyeonggi-do (KR). **윤종배 (YOON, Jong Bae)**; 440-300 경기도 수원시 장안구 정자동 928 청솔마을 SK 한화아파트 625-1203, Gyeonggi-do (KR). **박종성 (PARK, Jong Sung)**; 143-210 서울시 광진구 광장동 247-2 다인빌 302 호, Seoul (KR).

(74) 대리인: **김현진 (KIM, Hyun Jin)**; 135-080 서울시 강남구 역삼동 742-21 강남캐슬 201 호, Seoul (KR).

(81) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 권리의 보호를 위하여): 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, 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, QA, RO, RS, RU, RW, 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) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 역내 권리의 보호를 위하여): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 유라시아 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 유럽 (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).

공개:
— 국제조사보고서와 함께 (조약 제 21 조(3))

(54) Title: SPHERICAL PARTICLES OF CLOPIDOGREL BISULFATE, PHARMACEUTICAL COMPOSITION INCLUDING SAME, AND METHOD FOR MANUFACTURING SAME

(54) 발명의 명칭 : 클로피도그렐 황산수소염의 구형 입자, 이를 포함하는 약학적 조성물 및 이의 제조방법

(57) Abstract: The present invention relates to spherical particles of clopidogrel bisulfate having a 10% volume particle diameter (d0.1) of 30 μm or more and a 50% volume particle diameter (d0.5) in the range of 50 to 200 μm, and to a pharmaceutical composition including same. The spherical particles of the present invention not only significantly improve unfavorable properties in a conventional pharmaceutical preparation of clopidogrel bisulfate, i.e. defective compression and flow and a strong surface electrostatic force, but can also significantly reduce tableting impediments such as weight deviations and sticking during preparation by means of a direct powder compression technique, and the danger of crystalline conversion. Thus, the composition has improved physiochemical stability and, due to anti-clotting effects of the composition, can be effectively used as a therapeutic agent for arteriosclerosis, stroke, myocardial infarction, and atherosclerosis.

(57) 요약서: 본 발명은 30 μm 이상의 10% 체적 입경(d0.1) 및 50 내지 200 μm 범위의 50% 체적 입경(d0.5)을 가지는 클로피도그렐 황산수소염의 구형 입자 및 이를 포함하는 약학적 조성물에 관한 것으로서 본 발명의 구형 입자는 종래 클로피도그렐 황산수소염의 제제화하기 어려운 특성, 즉 불량한 압축성, 흐름성 및 강력한 표면 정전기력을 현저히 개선할 뿐만 아니라, 직접분말압축법에 의한 정제의 제조시 중량편차, 스티킹(sticking) 등의 타정 장애와 결정형 전환의 위험성을 현저히 줄일 수 있고, 물리화학적 안정성을 개선할 수 있는바, 항 혈전 효과에 의한 동맥경화증, 뇌졸중, 심근경색 및 죽상동맥경화증을 위한 치료제로 유용하게 사용될 수 있다.

WO 2013/008981 A1