

(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국

(43) 국제공개일
2012년 11월 1일 (01.11.2012)



(10) 국제공개번호
WO 2012/148181 A3

- (51) 국제특허분류:
A61K 9/22 (2006.01) A61K 47/38 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01) A61K 47/30 (2006.01)
- (21) 국제출원번호: PCT/KR2012/003223
- (22) 국제출원일: 2012년 4월 26일 (26.04.2012)
- (25) 출원언어: 한국어
- (26) 공개언어: 한국어
- (30) 우선권정보:
10-2011-0041150 2011년 4월 29일 (29.04.2011) KR
- (71) 출원인 (US 을(를) 제외한 모든 지정국에 대하여): 한국
유나이티드제약 주식회사 (KOREA UNITED
PHARM. INC.) [KR/KR]; 충청남도 연기군 전동면 노
장공단길 25-23, 339-841 Chungcheongnam-do (KR).
- (72) 발명자; 겸
- (75) 발명자/출원인 (US 에 한하여): 최연웅 (CHOI, Youn-
Woong) [KR/KR]; 경기도 안산시 단원구 당곡 2로 30,
901 동 903 호 (고잔동, 주공 9 단지아파트), 425-726
Gyeonggi-do (KR). 조상민 (CHO, Sang Min) [KR/KR];
경기도 용인시 기흥구 한보라 2로 141, 808 동 306 호

(공세동, 화성파크드림프라자아파트), 446-902 Gyeonggi-do (KR). 민병구 (MIN, Byung Gu) [KR/KR]; 서울특별시 은평구 불광로 122-10, 3205 동 703 호 (불광동, 북한산힐스테이트 3 차아파트), 122-040 Seoul (KR). 박진하 (PARK, Jin Ha) [KR/KR]; 경상남도 창원시 성산구 삼정자로 79, 114 동 201 호 (성주동, 유니온빌리지아파트), 641-939 Gyeongsangnam-do (KR). 김보경 (KIM, Bo Kyung) [KR/KR]; 서울특별시 관악구 문성로 28 길 30-5 (신림동), 151-901 Seoul (KR).

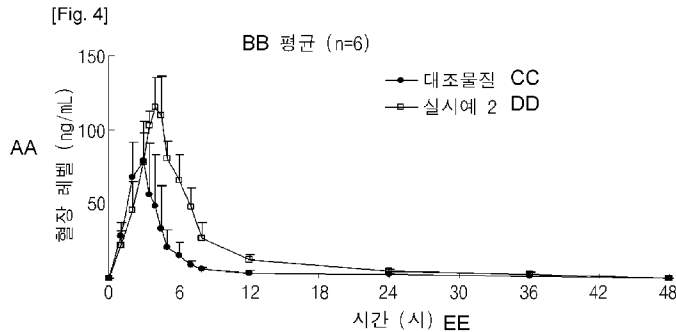
(74) 대리인: 특허법인주원 (B&IP-JOOWON PATENT AND LAW FIRM); 서울특별시 강남구 언주로 711, 건설회관 9층 (논현동), 135-701 Seoul (KR).

(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,

[다음 쪽 계속]

(54) Title: COMPOSITION FOR THE CONTROLLED-RELEASE OF DRUGS

(54) 발명의 명칭 : 약물 방출제어용 조성물



AA ... Plasma level
BB ... Average (n=6)
CC ... Control material
DD ... Embodiment 2
EE ... Time (hours)

(57) Abstract: The present invention relates to a composition for the controlled-release of drugs. More particularly, the composition for the controlled-release of drugs according to the present invention expands the capacity for the controlled-release of a matrix-type polymer for controlled-release via a carbomer in which said polymer for controlled-release forms a basic frame and in which sol-gel transition occurs in accordance with a pH level. The composition of the present invention is characterized in that it comprises: a solubilizing agent for the event the drug to be released is highly insoluble, and a disintegrating agent for sufficient initial release. The composition for the controlled-release of drugs according to the present invention uses a carbomer which maintains the controlled-release of conventional matrix structures having polymers for controlled-release and which has sol-gel transition properties, thus preventing a sudden release of a drug caused by a collapse of the matrix structure during a late stage of elution. In addition, the composition of the present invention uses a solubilizing agent to solve the problem of a highly insoluble drug failing to dissolve even after being released, and also uses a disintegrating agent to improve the speed of the initial release, which is the limiting factor in controlled-release preparations.

(57) 요약서:

[다음 쪽 계속]



WO 2012/148181 A3



SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(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, 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,

공개:

- 국제조사보고서와 함께 (조약 제 21 조(3))
- 청구범위 보정 기한 만료 전의 공개이며, 보정서를 접수하는 경우 그에 관하여 별도 공개함 (규칙 48.2(h))

(88) **국제조사보고서 공개일:** 2012년 12월 20일

본 발명은 약물 방출제어용 조성물에 관한 것이다. 구체적으로, 본 발명의 약물 방출제어용 조성물은 매트릭스 유형의 서방용 고분자가 기본 골격을 이루고, pH에 따라 졸-겔 변환이 일어나는 카보머로 상기 서방용 고분자의 방출제어능을 확충한다. 본 발명은 특히 방출 대상인 약물이 고난용성인 경우에 적합하도록 가용화제를, 그리고 충분한 초기 방출을 위해 방해제를 추가로 함유함을 특징으로 한다. 본 발명의 약물 방출제어용 조성물은 서방용 고분자가 갖는 종래 매트릭스 구조의 서방성을 보유하면서, 졸-겔 변환성질을 가진 카보머를 도입하여 용출 후기 매트릭스 구조의 붕괴로 인한 약물의 급격한 방출을 예방할 수 있다. 아울러, 가용화제의 도입으로 인해 고난용성의 약물이 방출 이후에도 용해되지 않는 문제점을 해결하였으며, 방해제를 도입하여 서방성 제제의 한계인 초기 방출속도를 향상시켰다.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/KR2012/003223

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A61K 9/22(2006.01)i, A61K 9/20(2006.01)i, A61K 47/38(2006.01)i, A61K 47/30(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A61K 9/22; A61K 9/14; A61K 9/20; A61K 31/4439; A61K 31/47; A61K 9/48; A61K 9/58; A61K 9/28

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched
Korean Utility models and applications for Utility models: IPC as above
Japanese Utility models and applications for Utility models: IPC as above

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

eKOMPASS (KIPO internal) & Keywords: controlled release polymer, carbomer, disintegrant, solubilizing agent, hydroxypropylcellulose, hydroxypropylcellulose, sodium lauryl sulfate, twin, chrosscamellose-Na, Chrospovidone, sustained release formulation, cilostazol, rebamipide

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	KR 10-2010-0027337 A (KOREA UNITED PHARM. INC) 11 March 2010 See abstract, descriptions [0007], [0009], [0012], [0016]-[0024] and examples 1 to 5, claims 1 to 5.	1-7
Y	US 7144585 B1 (T. MUKAI et al.) 05 December 2006 See abstract, line 35 of column 5-line 22 of column 6, lines 35-44 of column 8, line 63 of column 8-line 20 of column 9, examples 8, 13, 14 and all claims.	1-7
Y	KR 10-2007-0024254 A (KOREA OTSUKA PHARM. CO., LTD.) 02 March 2007 See abstract, table 1 and all claims.	1-7
Y	US 2011-0014282 A1 (T. C. DE VASCONCELOS) 20 January 2011 See abstract and all claims.	1-7
Y	KR 10-2007-0118444 A (SHIN POONG PHARMACEUTICAL CO., LTD) 17 December 2007 See abstract and all claims.	1-7
PX	KR 10-2011-0132170 A (KOREA UNITED PHARM. INC.) 07 December 2011 See abstract, descriptions [0002], [0019], [0022], [0036], [0045], [0046] and the claims.	1-5,7

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

10 OCTOBER 2012 (10.10.2012)

Date of mailing of the international search report

12 OCTOBER 2012 (12.10.2012)

Name and mailing address of the ISA/KR

Korean Intellectual Property Office
Government Complex-Daejeon, 139 Seonsa-ro, Daejeon 302-701,
Republic of Korea

Facsimile No. 82-42-472-7140

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/KR2012/003223

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member	Publication date
KR 10-2010-0027337 A	11.03.2010	KR 10-1008540 B	14.01.2011
US 7144585 B1	05.12.2006	AT 296100 T	15.06.2005
		AU 2000-31965 A1	16.10.2000
		AU 2000-31965 B2	16.06.2005
		CA 2368626 A1	05.10.2000
		CA 2368626 C	16.02.2010
		DE 60020343 D1	30.06.2005
		DE 60020343 T2	26.01.2006
		EG 23951 A	29.01.2008
		EP 1162973 A 1	19.12.2001
		EP 1162973 B 1	25.05.2005
		ES 2238994 T3	16.09.2005
		HK 1041649 A1	04.11.2005
		JP 04-641696 B2	10.12.2010
		JP 04-748839 B2	27.05.2011
		JP 2001-163769 A	19.06.2001
		JP 2011-063611 A	31.03.2011
		JP 4748839 B2	17.08.2011
		JP WO 01-023000 A1	05.04.2001
		PT 1162973 E	31.08.2005
		PT 1162973 T	31.08.2005
		TW 1263507 B	11.10.2006
		US 7138143 B1	21.11.2006
		WO 00-57881 A1	05.10.2000
		WO 01-23000 A1	05.04.2001
KR 10-2007-0024254 A	02.03.2007	NONE	
US 2011-0014282 A1	20.01.2011	AR 070731 A1	28.04.2010
		AU 2009-217865 A1	03.09.2009
		CA 2715802 A1	03.09.2009
		CN 101959504 A	26.01.2011
		EP 2259777 A2	15.12.2010
		IL 207512 D0	30.12.2010
		JP 2011-513301 A	28.04.2011
		JP 2011-513301 T	28.04.2011
		KR 10-2010-0126452 A	01.12.2010
		MX 2010009043 A	25.10.2010
		WO 2009-108077 A2	03.09.2009
		WO 2009-108077 A3	29.04.2010
KR 10-2007-0118444 A	17.12.2007	KR 10-0798730 B	29.01.2008
KR 10-2011-0132170 A	07.12.2011	WO 2011-152652 A2	08.12.2011

A. 발명이 속하는 기술분류(국제특허분류(IPC))
A61K 9/22(2006.01)i, A61K 9/20(2006.01)i, A61K 47/38(2006.01)i, A61K 47/30(2006.01)i

B. 조사된 분야

조사된 최소문헌(국제특허분류를 기재)
A61K 9/22; A61K 9/14; A61K 9/20; A61K 31/4439; A61K 31/47; A61K 9/48; A61K 9/58; A61K 9/28

조사된 기술분야에 속하는 최소문헌 이외의 문헌
한국등록실용신안공보 및 한국공개실용신안공보: 조사된 최소문헌란에 기재된 IPC
일본등록실용신안공보 및 일본공개실용신안공보: 조사된 최소문헌란에 기재된 IPC

국제조사에 이용된 전산 데이터베이스(데이터베이스의 명칭 및 검색어(해당하는 경우))
eKOMPASS(특허청 내부 검색시스템) & 키워드: 서방성 고분자, 카보머, 봉해제, 가용화제, 하이드록시프로필셀룰로오스, 하이 드록시프로필메틸셀룰로오스, 소디움 라우릴설페이트, 트윈, 크로스카멜로스 소디움, 크로스포비돈, 서방성 제제, 실로스타졸, 레바미피드

C. 관련 문헌

카테고리*	인용문헌명 및 관련 구절(해당하는 경우)의 기재	관련 청구항
Y	KR 10-2010-0027337 A (한국유나이티드제약 주식회사) 2010.03.11 요약, 명세서 [0007], [0009], [0012], [0016]-[0024] 및 실시예 1 내지 5, 청구항 제1항 내지 제5항 참조.	1-7
Y	US 7144585 B1 (T. MUKAI 외 4명) 2006.12.05 초록, 컬럼 5의 35 제줄-컬럼 6의 22 제줄, 컬럼 8의 35-44 제줄, 컬럼 8의 63 제줄-컬럼 9의 20 제줄, 실시예 8, 13, 14 및 전체 청구항 참조.	1-7
Y	KR 10-2007-0024254 A (한국오츠카제약 주식회사) 2007.03.02 요약, 표 1 및 전체 청구항 참조.	1-7
Y	US 2011-0014282 A1 (T. C. DE VASCONCELOS) 2011.01.20 초록 및 전체 청구항 참조.	1-7
Y	KR 10-2007-0118444 A (신풍제약주식회사) 2007.12.17 요약 및 전체 청구항 참조.	1-7
PX	KR 10-2011-0132170 A (한국유나이티드제약 주식회사) 2011.12.07 초록, 명세서 [0002], [0019], [0022], [0036], [0045], [0046] 및 청구항 참조.	1-5,7

추가 문헌이 C(계속)에 기재되어 있습니다. 대응특허에 관한 별지를 참조하십시오.

* 인용된 문헌의 특별 카테고리:
 “A” 특별히 관련이 없는 것으로 보이는 일반적인 기술수준을 정의한 문헌 “T” 국제출원일 또는 우선일 후에 공개된 문헌으로, 출원과 상충하지
 않으며 발명의 기초가 되는 원리나 이론을 이해하기 위해 인용된
 문헌
 “E” 국제출원일보다 빠른 출원일 또는 우선일을 가지나 국제출원일 이후 “X” 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌 하나만으로 청구된 발명의 신
 규성 또는 진보성이 없는 것으로 본다.
 에 공개된 선출원 또는 특허 문헌
 “L” 우선권 주장에 의문을 제기하는 문헌 또는 다른 인용문헌의 공개일 “Y” 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌이 하나 이상의 다른 문헌과
 조합하는 경우로 그 조합이 당업자에게 자명한 경우 청구된 발명
 은 진보성이 없는 것으로 본다.
 또는 다른 특별한 이유(이유를 명시)를 밝히기 위하여 인용된 문헌
 “O” 구두 개시, 사용, 전시 또는 기타 수단을 언급하고 있는 문헌
 “P” 우선일 이후에 공개되었으나 국제출원일 이전에 공개된 문헌 “&” 동일한 대응특허문헌에 속하는 문헌

국제조사의 실제 완료일 2012년 10월 10일 (10.10.2012)	국제조사보고서 발송일 2012년 10월 12일 (12.10.2012)
--	--

ISA/KR의 명칭 및 우편주소 대한민국 특허청 (302-701) 대전광역시 서구 청사로 189, 4동 (둔산동, 정부대전청사) 팩스 번호 82-42-472-7140	심사관 이선화 전화번호 82-42-481-5606
--	-----------------------------------



국제조사보고서에서 인용된 특허문헌	공개일	대응특허문헌	공개일
KR 10-2010-0027337 A	2010.03.11	KR 10-1008540 B	2011.01.14
US 7144585 B1	2006.12.05	AT 296100 T	2005.06.15
		AU 2000-31965 A1	2000.10.16
		AU 2000-31965 B2	2005.06.16
		CA 2368626 A1	2000.10.05
		CA 2368626 C	2010.02.16
		DE 60020343 D1	2005.06.30
		DE 60020343 T2	2006.01.26
		EG 23951 A	2008.01.29
		EP 1162973 A1	2001.12.19
		EP 1162973 B1	2005.05.25
		ES 2238994 T3	2005.09.16
		HK 1041649 A1	2005.11.04
		JP 04-641696 B2	2010.12.10
		JP 04-748839 B2	2011.05.27
		JP 2001-163769 A	2001.06.19
		JP 2011-063611 A	2011.03.31
		JP 4748839 B2	2011.08.17
		JP WO 01-023000 A1	2001.04.05
		PT 1162973 E	2005.08.31
		PT 1162973 T	2005.08.31
		TW 1263507 B	2006.10.11
		US 7138143 B1	2006.11.21
		WO 00-57881 A1	2000.10.05
		WO 01-23000 A1	2001.04.05
KR 10-2007-0024254 A	2007.03.02	없음	
US 2011-0014282 A1	2011.01.20	AR 070731 A1	2010.04.28
		AU 2009-217865 A1	2009.09.03
		CA 2715802 A1	2009.09.03
		CN 101959504 A	2011.01.26
		EP 2259777 A2	2010.12.15
		IL 207512 D0	2010.12.30
		JP 2011-513301 A	2011.04.28
		JP 2011-513301 T	2011.04.28
		KR 10-2010-0126452 A	2010.12.01
		MX 2010009043 A	2010.10.25
		WO 2009-108077 A2	2009.09.03
		WO 2009-108077 A3	2010.04.29
KR 10-2007-0118444 A	2007.12.17	KR 10-0798730 B	2008.01.29
KR 10-2011-0132170 A	2011.12.07	WO 2011-152652 A2	2011.12.08