

(19) DANMARK

(10) DK 2002 01960 L



(12) PATENTANSØGNING

Patent- og
Varemærkestyrelsen

(51) Int.Cl⁷: C 08 B 37/16

(21) Patentansøgning nr: PA 2002 01960

(22) Indleveringsdag: 2002-12-20

(24) Løbedag: 1986-03-14

(41) Alm. tilgængelig: 2002-12-20

(30) Prioritet: 1985-03-15 GB 85 06 792

(71) Ansøger: JANSSEN PHARMACEUTICA N.V., Turnhoutseweg 30, B-2340-Beerse, Belgien

(72) Opfinder: Bernd Willi Werner Müller, Schlotfeldsberg 14a, D-2302 Flintbek, Tyskland

(74) Fuldmægtig: Budde, Schou & Ostenfeld A/S, Vester Søgade 10, 1601 København V, Danmark

(54) Benævnelse: Nye derivater af γ -cyclodextrin, fremgangsmåder til deres fremstilling samt præparater indeholdende disse og fremgangsmåder til deres fremstilling

(57) Sammendrag:

Der beskrives nye derivater af γ -cyclodextrin med større tilbøjelighed til inklusionskompleksdannelse og fordelagtige toksikologiske egenskaber, deres fremstilling og anvendelse som kompleksdannelses- og solubiliseringssmidler, samt præparater indeholdende disse γ -cyclodextrinderivater og fremgangsmåder til fremstilling af sådanne præparater.

PATENTKRAV

1. γ -cyclodextrinether eller blandet ether, KENDETEGNET ved, at ethersubsti-
5 tuenterne er C_{1-6} alkyl, undtaget er octakis-(2,6-di-O-methyl)- γ -cyclodextrin og
per-O-methyleret γ -cyclodextrin.
2. γ -cyclodextrinether eller blandet ether ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, at
ethersubstituenterne er C_{1-3} alkyl.
10
3. γ -cyclodextrinderivat ifølge krav 1, KENDETEGNET ved, at substituenterne
er methyl, ethyl eller isopropyl.
4. γ -cyclodextrinderivat ifølge krav 1 eller 2, KENDETEGNET ved, at substitu-
15 tionsgraden ligger i området fra 0,125 til 3 og M.S. i området fra 0,125 til 10.
5. γ -cyclodextrinderivat ifølge krav 1 eller 2, KENDETEGNET ved, at substitu-
tionsgraden ligger i området fra 0,3 til 2 og M.S. i området fra 0,3 til 3.
- 20 6. Fremgangsmåde til fremstilling af en forbindelse ifølge et hvilket som helst af
kravene 1-5, KENDETEGNET ved, at man omsætter γ -cyclodextrin med et O-
alkyleringsmiddel.
7. Fremgangsmåde ifølge krav 6, KENDETEGNET ved, at den udføres i et re-
25 aktionsinert opløsningsmiddel i nærværelse af en base ved en temperatur
mellem 30°C og 200°C.
8. Præparat, KENDETEGNET ved, at det omfatter en aktiv ingrediens og et γ -
cyclodextrinderivat ifølge et hvilket som helst af kravene 1-5.
30
9. Præparat ifølge krav 8, KENDETEGNET ved, at den aktive ingrediens er et
lægemiddel.

10. Præparat ifølge krav 9, KENDETEGNET ved, at den aktive ingrediens er et ikke-steroidt anti-rheumatisk middel, et steroid, et cardialt glycosid eller et derivat af benzodiazepin, benimidazol, piperidin, piperazin, imidazol, triazol, pyridazin, 1,2,4-triazindion, 2,3,5,6-tetrahydroimidazo[2.1-b]thiazol eller
5 hydratropinsyre eller et amid- eller trialkylaminderivat.

11. Præparat ifølge krav 8, KENDETEGNET ved at lægemidlet er etomidat.

12. Præparat ifølge krav 8, KENDETEGNET ved at lægemidlet er ketoconazol.
10

13. Præparat ifølge krav 8, KENDETEGNET ved at lægemidlet er itraconazol.

14. Præparat ifølge krav 8, KENDETEGNET ved at lægemidlet er flunarizin.

15 15. Fremgangsmåde til fremstilling af et præparat ifølge et hvilket som helst af kravene 8-14, KENDETEGNET ved, at γ -cyclodextrinetheren opløses i vand og at den aktive ingrediens tilsættes, hvorefter den således opnåede opløsning eventuelt tørres.

20 16. Fremgangsmåde ifølge krav 15, KENDETEGNET ved at resten efter tørring pulveriseres og, eventuelt efter tilsætning af yderligere ingredienser, omdannes til fast form til administrering.

25 17. Fremgangsmåde ifølge krav 15 eller 16, KENDETEGNET ved, at yderligere fysiologisk acceptable stoffer tilsættes vandet.

18. Fremgangsmåde ifølge krav 17, KENDETEGNET ved, at natriumchlorid, glukose, mannitol, sorbitol, xylitol eller en fosfat- eller cirtatbuffer tilsættes vandet.