

**(19) 대한민국특허청(KR)**  
**(12) 국제특허출원의 출원공개공보(A)**

(51) Int. Cl.<sup>6</sup>

A61K 9/48

A61K 47/10

(11) 공개번호 특 1995-0703333

(43) 공개일자 1995년 09월 20일

(21) 출원번호 특 1995-0701257

(22) 출원일자 1995년 04월 01일

번역문제출원일자 1995년 04월 01일

(86) 국제출원번호 PCT/US 93/008107 (87) 국제공개번호 WO 94/007472

(86) 국제출원출원일자 1993년 09월 02일 (87) 국제공개일자 1994년 04월 14일

(81) 지정국 EP 유럽특허 : 오스트리아 벨기에 스위스(리히텐스타인) 덴마크 스페인 프랑스 영국 그리스 아일랜드 이탈리아 툴센부르크 모나코 네덜란드 포루투갈 스웨덴

국내특허 : 오스트레일리아 캐나다 일본 대한민국 노르웨이 뉴질랜드 미국

(30) 우선권주장 07/955962 1992년 10월 02일 미국(US)

(71) 출원인 화이자 인크 알렌 제이. 스피겔

미합중국 10017 뉴욕주 뉴욕시 이스트 42번지 235

(72) 발명자 쿠라톨로, 월리암, 제이.

미합중국 06537 코네티컷주 니안틱 패트릭 플레이스 18

굼코우스키, 마이클, 제이.

미합중국 06320 코네티컷주 뉴 런던 탬즈 스트리트 128

로, 줄리안, 비.

미합중국 06371 코네티컷주 올드 라임 올드 스타게코우치 로드 20

(74) 대리인 주성민, 김성택

**심사청구 : 있음****(54) 비이온계 계면활성제 함유 약학 조성물(Pharmaceutical Compositions Containing Nonionic Surfactants)****요약**

본 발명의 약한 조성물은 장벽을 투과할 수 있는 효소적으로 불안정한 약학 활성제를 포함하거나 또는 장벽을 투과하기 위한 장벽 투과성 증진제 및 상기 활성제가 효소에 의해서 불활성화 되는 것을 방지할 수 있는 하나 이상의 비이온계 계면활성제를 필요로 한다. 효소적으로 불안정한 약학 활성제의 위장 효소에 의한 분해를 저해하는 방법은 상기 활성제를 비이온계 계면활성제와 혼합시키는 것을 포함한다.

**명세서**

[발명의 명칭]

비이온계 계면활성제 함유 약학 조성물(Pharmaceutical Compositions Containing Nonionic Surfactants)

본 내용은 요부공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

**(57) 청구의 범위****청구항 1**

장벽을 투과할 수 있는 효소적으로 불안정한 약학 활성제 및 상기 활성제가 효소에 의해서 불활성화되는 것을 방지할 수 있는 하나 이상의 비이온계 계면활성제를 포함하는 것을 특징으로 하는 경구 투여용 약한 조성물.

**청구항 2**

제1항에 있어서, 상기 활성제는 분자량이 약 3,000 미만인 펩타이드인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, 상기 비이온계 계면활성제가 에톡실화 알코올, 에톡실화 지방산, 소르비탄 유도체, 에톡실화 알킬 페놀, 또는 모노글리세리드인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 4

제3항에 있어서, 상기 비이온계 계면활성제가 에톡실화 라우르산, 폴리옥시에틸렌(40) 스테아레이트, 폴리옥시에틸렌(20) 소르비탄 모노올레이어트, 폴리옥시에틸렌(23) 라우릴 에테르, 노닐 페녹시풀리(에틸렌옥시)에탄올-30, 노닐페녹시풀리(에틸렌옥시)에탄올-50, 또는 글리세릴과 야자씨유의 폴리에틸렌글리콜-1500에스테르의 혼합물, 모노-옥타노인, 모노데카노인, 또는 모노-올레인인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 5

제1항 내지 제4항중 어느 한 항에 있어서, 오일이 포함되는 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 6

제5항에 있어서, 상기 오일 모노글리세리드, 디글리세리드, 또는 트리글리세리드 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 7

제6항에 있어서, 상기 트리글리세리드가 식물성유 또는 카프릭산/카프르산 트리글리세리드이고, 상기 모노글리세리드가 모노옥타노인 또는 모노데카노인이고 상기 디글리세리드가 글리셀릴-1,2-디옥타노에이트인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 8

(1) 장벽 투과성 증진제의 존재하에서만 장벽을 투과할 수 있는 효소적으로 불안정한 약학 활성제, (2) 상기 활성제가 효소에 의해서 불활성화되는 것을 방지 할 수 있고 장벽 투과성 증진제가 아닌 하나 이상의 비이온계 계면활성제 및 (3) 상기 비이온계 계면활성제 이외의 장벽 투과성 증진제를 포함하는 경우 투여용 약학 조성물.

#### 청구항 9

제8항에 있어서, 비이온계 계면활성제가 약 14 내지 다 20의 HBL 값을 갖는 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 10

제9항에 있어서, 상기 비이온계 계면활성제가 에톡실화 알코올, 에톡실화 지방산, 소르비탄 유도체, 에톡실화 알킬 페놀, 또는 모노글리세리드인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 11

제10항에 있어서, 상기 비이온계 계면활성제가 에톡실화 라우르산, 폴리옥시에틸렌(40) 스테아레이트, 폴리옥시에틸렌(20) 소르비탄 모노올레이어트, 폴리옥시에틸렌(23) 라우릴 에테르, 또는 노닐페녹시풀리(에틸렌옥시)에탄올-30, 노닐페녹시풀리(에틸렌옥시)에탄올-50, 글리세릴과 야자씨유의 폴리에틸렌글리콜-1500에스테르의 혼합물, 모노옥타노인, 모노데카노인, 또는 모노올레인인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 12

제8항에 있어서, 활성제가 분자량이 약 150 내지 150,000인 폴리펩타이드인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 13

효소에 의해 장벽을 투과할 수 있는 효소적으로 불안정한 약학 활성제를 상기 활성제가 효소에 의해서 불활성화되는 것을 방지할 수 있는 비이온계 계면활성제와 혼합시키는 것을 특징으로 하는 상기 활성제의 문제를 저해시키는 방법.

#### 청구항 14

제13항에 있어서, 상기 활성제가 분자량이 약 3000 미만인 펩타이드인 것이 특징인 방법.

#### 청구항 15

제13항에 있어서, 상기 비이온계 계면활성제가 에톡실화 알코올, 에톡실화 지방산, 소르비탄 유도체, 에톡실화 알킬 페놀, 또는 모노글리세리드인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 16

제13항에 있어서, 상기 비이온계 계면활성제가 에톡실화 라우르산, 폴리옥시에틸렌(40) 스테아레이트, 폴리옥시에틸렌(20) 소르비탄 모노올레이어트, 폴리옥시에틸렌(23) 라우릴 에테르, 또는 노닐페녹시풀리(에틸렌옥시)에탄올-30, 노닐페녹시풀리(에틸렌옥시)에탄올-50, 글리세릴과 야자씨유의 폴리에틸렌글리콜-1500에스테르의 혼합물, 모노옥타노인, 모노데카노인, 또는 모노올레인인 것이 특징인 조성물.

#### 청구항 17

장벽을 투과할 수 있는 효소적으로 불안정한 약학 활성제를 상기 활성제가 효소제 의해 불활성화되는 것을 방지할 수 있는 하나 이상의 비이온계 계면활성제와 동시 투여하는 것을 특징으로 하는 상기 활성제를 환자에게 경구 투여하는 방법.

#### 청구항 18

장벽 투과성 증진제의 존재하에서만 장벽을 투과할 수 있는 효소적으로 불안정한 약학 활성제, 상기 활성제가 효소에 의해서 불활성되는 것을 방지할 수 있고 장벽 투과성 증진제가 아닌 하나 이상의 비이온계 계면활성제 및 상기 비이온계 계면활성제 이외의 장벽 투과성 증진제를 환자에게 동시 투여하는 것이 특징인 활성제를 환자에게 경구 투여하는 방법.

#### 청구항 19

위 또는 장에서 구소적으로 그 치료 활성이 나타나는 효소적으로 불안정한 약학 활성제 및 상기 활성제가 효소에 의해서 불활성화되는 것을 방지할 수 있는 하나 이상의 비이온계 계면활성제를 포함하는 경구 투여용 약학 조성물.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.