

# (19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>  
A61K 31/565

(11) 공개번호 특1984-0005021  
(43) 공개일자 1984년11월03일

(21) 출원번호	특1983-0002461
(22) 출원일자	1983년06월02일
(30) 우선권주장	95070 1982년06월02일 일본(JP)
(71) 출원인	다케다 야구헝 고오교 가부시끼 가이사 구라바야시 이꾸시로 일본국 오오사카후 히가시꾸 도쇼오마찌 2쵸메 27반찌
(72) 발명자	오가와 야스아끼
(74) 대리인	일본국 오오사카후 이바리끼시 나카호즈미 1-7-32-503 이준구, 백락신

심사청구 : 없음

(54) 구강투여용 항안드로겐 제제

## 요약

내용 없음

## 명세서

[발명의 명칭]

구강투여용 항안드로겐 제제

본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음

## (57) 청구의 범위

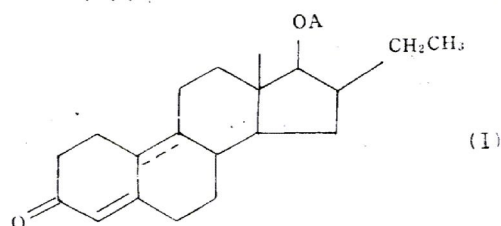
### 청구항 1

시험샘플을 하기 (c)와 같이 정의된 보조튜브의 내부에 접촉시키고 이샘플이 든 튜브를 37±0.5° C의 물 1000ml가 든 하기 (a)와 같이 정의된 용기에 넣고, 상기 용기의 저부로부터 5.0cm 위에 패들이 위치하도록 하기 (b)에 정의된 교반기를 장치하고 이 교반기를 100rpm의 속도로 운행함으로써 샘플의 분해에 필요한 시간을 실제로 37±0.5° C에서 측정하는 분해시험에 의하여 30분 이상의 분해시간을 갖는 투여 단위를 형성하는, 하기 일반식(1)의 항안드로겐 활성화합물 및 적절한 성분으로 이루어지는 구강막을 통하여 흡수되는 약학적 제제.

[(a) 160~175mm의 높이 및 50~52.5mm의 반경을 가진 1000ml들이 둥근 바닥 실린더이며 그의 상부입구가 마개를 유지하기 위해 주변이 평평한 플랜지이며, 마개는 직경 140mm 및 두께 4mm의 투명한 원형이며 직경 16mm의 구멍이 중심에 있고 마개의 가장자리로부터 12mm 되는 곳에 홈모양의 불럭이 있는 투명 플라스틱재 용기.

(b) 샤프트 저어날부의 직경이 6.0~10.5mm이고 물이 잠긴 부분의 직경이 9.5~10.5mm이고 총 길이가 370~400mm이며 패들은 샤프트의 저단부에 위치하는데, 직경 83mm, 두께 3.0~5.0mm의 원형 플레이트로부터 75±1mm 및 42±1mm의 평행한 2개의 다른 현으로 형성되며,상기 두 평행현 사이의 중간부분이 상기 패들의 치수이며 42mm 현이 샤프트 중심으로부터 아래쪽에 있는 교반기.

(c) 외직경 17mm, 내직경 12mm 및 길이 20mm의 투명플라스틱재 튜브의 양외측 단부에 나사부를 달고, 직경이 같으며 길이가 2.5mm인 두개의 짧은 튜브를 20mm튜브의 단부가 겹쳐질 수 있도록 양내측 단부상에 상기와 같이 나사부를 달고, 와이어가 0.29mm이고, 오프닝이 0.42mm인 두개의 내산성 네트가 20mm 튜브의 양입구에서 나사로 꼭 밀폐된 보조튜브.]



(상기 식에서 10위치의 점선은 포화 또는 불포화 결합을 나타내고, A는 수소원자, 또는 에테르 또는 에스테르 잔기를 나타냄).

## 청구항 2

제1항에 있어서, 일반식(I)로 표시되는 상기 화합물이 16β-에틸-17β-히드록시-4-에스트렌-3-온, 16β-에틸-17β-아세테이트-4-에스트렌-3-온 또는 16β-에틸-17β-카프릴레이트-4-에스트렌-3-온인 제제.

## 청구항 3

제1항에 있어서, 상기 투여단위가 정제, 환약 또는 좌약의 형태인 제제.

## 청구항 4

제3항에 있어서, 상기 투여단위가 정제의 형태인 제제.

## 청구항 5

제4항에 있어서, 상기 정제가 20~60%의 에스트란(I), 7~30%의 방출 조절제를 포함하도록 1300~2000kg/cm<sup>2</sup>의 압력으로 정제화되는 제제.

## 청구항 6

제4항에 있어서, 상기 정제가 6~12mm의 직경 및 0.5~2.5mm의 두께를 가지는 제제.

## 청구항 7

제1항에 있어서, 상기 구강에 윗치은강은 제제.

## 청구항 8

제1항에 있어서, 상기 분해시간이 30분~10시간인 제제.

## 청구항 9

제1항에 있어서, 상기 조제가 부형제, 방출조절제, 결합제, 윤활제, 흡착제 및/또는 고정약을 함유하는 제제.

## 청구항 10

제9항에 있어서, 상기 방출 조절제가 히드루시 프로필 셀룰로오즈의 제제.

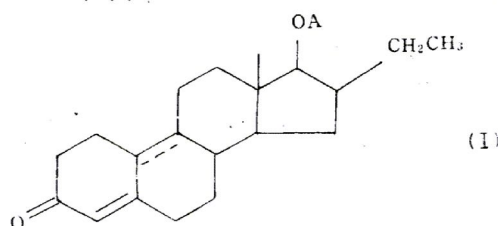
## 청구항 11

시험샘플을 하기(c)와 같이 정의된 보조튜브의 내부에 접촉시키고 이 샘플이 든 튜브를 37±0.5° C의 물 1000ml가 든 하기(a)와 같이 정의된 용기에 넣고, 상기 용기의 저부로부터 5.0cm 위에 패들이 위치하도록 하기(b)에 정의된 교반기를 장치하고 이 교반기를 100rpm의 속도로 운행함으로써 샘플의 분해에 필요한 시간을 실제로 37±0.5° C에서 측정하는 분해시험에 의하여 30분 이상의 분해시간을 갖는 투여단위를 하기 화합물(I) 및 적절한 성분에 의해 제조하고 이 투여단위를 동물 또는 인체의 구강에 투여함을 특징으로 하는 하기 일반식(I)을 갖는 항안드로겐 활성화화합물의 투여방법.

[(a) 160~175mm의 높이 및 50~52.5mm의 반경을 가진 1000ml들이 둥근바닥 실린더이며 그의 상부입구가 마개를 유지하기 위해 주변이 평평한 플랜지이며, 마개는 140mm 및 두께 4mm의 투명한 원형이며 직경 16mm의 구멍이 중심에 있고 마개의 가장자리로부터 12mm 되는 곳에 홈모양의 불릿이 있는 투명 플라스틱 제 용기.

(b) 샤프트 저어널부의 직경이 6.0~10.5mm이고 물이 잠긴 부분에 직경이 9.5~10.5mm이고 총길이가 370~400mm이며 패들은 샤프트의 저단부에 위치하는데, 직경 83mm, 두께 3.0~5.0mm의 원형 플레이트로부터 75±1mm 및 42±1mm의 평행한 2개의 다른 현으로 형성되며 상기 두 평행현 사이의 중간 부분이 상기 패들의 치수이며 42mm 현이 샤프트 중심으로부터 아래쪽에 있는 교반기.

(c) 외직경 17mm, 내직경 12mm 및 길이 20mm의 투명플라스틱재 튜브의 양외측 단부에 나사부를 달고, 직경이 같으며 길이가 2.5mm인 두개의 짧은 튜브를 20mm 튜브의 단부가 겹쳐질 수 있도록 양내측 단부상에 상기와 같이 나사부를 달고, 와이어가 0.29mm이고 오프팅이 0.42mm인 두개의 내산성 네트가 20mm 튜브의 양 입구에서 나사로 꼭 밀폐된 보조튜브.]



(상기 식에서 10위치의 점선은 포화 또는 불포화 결합을 나타내고, A는 수소원자 또는 에테르 또는 에스테르 잔기를 나타냄).

#### 청구항 12

20~60%의 에스트란(I), 7~30%의 방출조절제 및 기타 적당한 조제물질을 조제하고, 1300~2000kg/cm<sup>2</sup>의 압력으로 정제화합을 특징으로 하는 투여단위의 제조방법.

※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.