

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2010135831/15, 04.03.2009

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
07.03.2008 US 61/034,947

(43) Дата публикации заявки: 20.04.2012 Бюл. № 11

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 07.10.2010(86) Заявка РСТ:
IB 2009/000442 (04.03.2009)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2009/109844 (11.09.2009)Адрес для переписки:
191036, Санкт-Петербург, а/я 24,
"НЕВИНПАТ", пат.пов. А.В.Поликарпову

(71) Заявитель(и):

Пфайзер Инк. (US)

(72) Автор(ы):

КУРАТОЛО Уильям Джон (US),
ХЕРБИГ Скотт Макс (US),
ТОМБРЕ Авинаш Говинд (US),
ШАХ Джеймин Чандракант (US),
ШАМБЛИН Шерри Л. (US),
ЛУКАС Тимоти (US),
КЭЛДУЭЛЛ Уильям Бретт (US),
ФРЕЙЗЕН Дуэйн Томас (US),
ЛИОН Дэвид Кейт (US),
КРЕЙГ Кристофер Донован (US)(54) СПОСОБЫ, ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ФОРМЫ И НАБОРЫ ДЛЯ ВВЕДЕНИЯ ЗИПРАСИДОНА
БЕЗ ПИЩИ

(57) Формула изобретения

1. Способ лечения расстройства ЦНС (центральной нервной системы) у человека, включающий введение человеку натощак твердой пероральной лекарственной формы, содержащей количество зипрасидона, эффективное для лечения указанного расстройства ЦНС, где площадь под кривой концентрации зипрасидона в сыворотке относительно времени ($AUC_{0-\text{inf}}$) у человека после указанного введения составляет от 70% до 140% средней площади под кривой концентрации зипрасидона в сыворотке относительно времени ($AUC_{0-\text{inf}}$), полученной в результате введения контрольной пероральной капсулы зипрасидона с немедленным высвобождением, содержащей такое же количество зипрасидона, группе людей в сытом состоянии.

2. Способ лечения расстройства ЦНС у человека, включающий введение человеку натощак твердой пероральной лекарственной формы, содержащей количество зипрасидона, эффективное для лечения указанного расстройства ЦНС, где площадь под кривой концентрации зипрасидона в сыворотке относительно времени ($AUC_{0-\text{inf}}$) у человека после указанного введения составляет от 70% до 140% средней площади под кривой концентрации зипрасидона в сыворотке относительно времени ($AUC_{0-\text{inf}}$), полученной в результате введения идентичной твердой пероральной лекарственной формы, содержащей такое же количество зипрасидона, группе людей в сытом состоянии.

RU 2010135831 A

RU 2010135831 A

3. Способ лечения расстройства ЦНС у человека, включающий введение человеку натощак твердой пероральной лекарственной формы, содержащей эффективное количество зипрасидона, где $AUC_{0-\infty}$ зипрасидона в сыворотке у человека после указанного введения составляет от 70% до 140% средней $AUC_{0-\infty}$ зипрасидона в сыворотке, полученной в результате введения контрольной пероральной капсулы зипрасидона с немедленным высвобождением, содержащей такое же количество зипрасидона, группе людей в сытом состоянии, и также составляет от 70% до 140% средней $AUC_{0-\infty}$ зипрасидона в сыворотке, полученной в результате введения идентичной твердой пероральной лекарственной формы, содержащей такое же количество зипрасидона, группе людей в сытом состоянии.

4. Способ по п.1, где максимальная концентрация зипрасидона в сыворотке (C_{max}) после введения натощак составляет менее чем примерно 140% максимальной концентрации зипрасидона в сыворотке (C_{max}), полученной в результате введения контрольной пероральной капсулы зипрасидона с немедленным высвобождением, содержащей такое же количество зипрасидона, человеку в сытом состоянии.

5. Способ лечения расстройства ЦНС у человека, включающий введение человеку натощак твердой пероральной лекарственной формы, содержащей эффективное количество зипрасидона, обеспечивающей данному человеку в голодном состоянии минимальную концентрацию зипрасидона в крови (C_{min}) в равновесном состоянии по меньшей мере 20 нг/мл и максимальную концентрацию зипрасидона в крови (C_{max}) в равновесном состоянии менее чем 330 нг/мл.

6. Способ по любому из пп.1, 2, 3, 4 или 5, где зипрасидон в лекарственной форме содержит зипрасидон в форме с улучшенной скоростью растворения или в форме с улучшенной растворимостью и/или зипрасидон в комбинации с ингибитором осаждения.

7. Способ по п.6, где зипрасидон в лекарственной форме содержит зипрасидона тозилат, зипрасидона тартрат или зипрасидон в комбинации с циклодекстрином.

8. Способ по п.6, где зипрасидон в лекарственной форме содержит наночастицы зипрасидона.

9. Способ по п.6, где зипрасидон в лекарственной форме содержит твердую смесь зипрасидона и полимер, причем по меньшей мере часть зипрасидона в данной твердой смеси находится в полуупорядоченном состоянии.

10. Способ по п.6, где твердая пероральная лекарственная форма содержит средство для замедленного высвобождения, средство для отложенного высвобождения, часть для немедленного высвобождения или любую их комбинацию.

11. Способ по любому из пп.1, 2 или 3, где твердая пероральная лекарственная форма содержит средство для замедленного высвобождения и возможно средство для отложенного высвобождения и/или часть для немедленного высвобождения, и где зипрасидон в данной твердой пероральной лекарственной форме содержит твердую смесь зипрасидона с полимером, причем по меньшей мере часть зипрасидона находится в полуупорядоченном состоянии.

12. Способ по любому из пп.1, 2 или 3, где твердая пероральная лекарственная форма представляет собой таблетку с немедленным высвобождением или таблетку с замедленным высвобождением, содержащую твердую смесь, содержащую полуупорядоченный зипрасидона гидрохлорид и гидроксипропилметилцеллюлозы ацетат сукцинат (HPMCAS).

13. Способ по любому из пп.1, 2 или 3, где твердая пероральная лекарственная форма содержит часть для немедленного высвобождения и часть для замедленного высвобождения, где часть для замедленного высвобождения содержит твердую смесь, содержащую полуупорядоченный зипрасидона гидрохлорид и HPMCAS.

14. Способ по любому из пп.1, 2, 3, 4 или 5, где человек в голодном состоянии не потребил 250 калорий или более в течение по меньшей мере двух часов до и по меньшей мере двух часов после введения твердой пероральной лекарственной формы.

15. Способ по п.6, где человек в голодном состоянии не потребил 250 калорий или более в течение по меньшей мере двух часов до и по меньшей мере двух часов после введения данной твердой пероральной лекарственной формы.

16. Набор, содержащий

а) твердую пероральную лекарственную форму, содержащую эффективное количество зипрасидона и фармацевтически приемлемый носитель; и

б) инструкции для перорального введения лекарственной формы (а), которые

1) не предписывают введение с пищей или

2) указывают, что лекарственную форму (а) можно вводить с пищей или без пищи; где указанная твердая пероральная лекарственная форма при введении человеку натощак обеспечивает данному человеку $AUC_{0-\text{inf}}$ зипрасидона в сыворотке, которая составляет от 70% до 140% средней $AUC_{0-\text{inf}}$ зипрасидона в сыворотке, полученной в результате введения контрольной пероральной капсулы зипрасидона с немедленным высвобождением, содержащей такое же количество зипрасидона, группе людей в сытом состоянии.

17. Набор, содержащий

а) твердую пероральную лекарственную форму, содержащую эффективное количество зипрасидона и фармацевтически приемлемый носитель; и

б) инструкции для перорального введения лекарственной формы (а), которые

1) не предписывают введение с пищей или

2) указывают, что лекарственную форму (а) можно вводить с пищей или без пищи; где указанная твердая пероральная лекарственная форма при введении человеку натощак обеспечивает данному человеку $AUC_{0-\text{inf}}$ зипрасидона в сыворотке, которая составляет от 70% до 140% средней $AUC_{0-\text{inf}}$ зипрасидона в сыворотке, полученной в результате введения идентичной твердой пероральной лекарственной формы зипрасидона, содержащей такое же количество зипрасидона, группе людей в сытом состоянии.

18. Набор по п.16 или 17, где зипрасидон содержит зипрасидон в форме с улучшенной скоростью растворения или в форме с улучшенной растворимостью и/или зипрасидон в комбинации с ингибитором осаждения.

19. Твердая пероральная лекарственная форма, содержащая фармацевтически приемлемый носитель и количество зипрасидона, эффективное для лечения расстройства ЦНС, которая содержит зипрасидон в форме с улучшенной скоростью растворения или в форме с улучшенной растворимостью и которая обеспечивает человеку в голодном состоянии площадь под кривой концентрации зипрасидона в сыворотке относительно времени ($AUC_{0-\text{inf}}$), которая составляет от 70% до 140% средней площади под кривой концентрации зипрасидона в сыворотке относительно времени ($AUC_{0-\text{inf}}$), полученной в результате введения идентичной твердой пероральной лекарственной формы, содержащей такое же количество зипрасидона, группе людей в сытом состоянии.

20. Твердая пероральная лекарственная форма по п.19, где количество зипрасидона в данной лекарственной форме составляет 20, 40, 60 или 80 мгА (мг активного зипрасидона).