



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012113253/15, 17.09.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
17.09.2009 US 61/243,487

(43) Дата публикации заявки: 27.10.2013 Бюл. № 30

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 17.04.2012(86) Заявка РСТ:  
US 2010/049203 (17.09.2010)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/035079 (24.03.2011)Адрес для переписки:  
191036, Санкт-Петербург, а/я 24, "НЕВИНПАТ"

(71) Заявитель(и):

Апталис фарматек, Инк. (US)

(72) Автор(ы):

ВЕНКАТЕШ Голи М. (US),  
ПЕРРЕТТ Стивен (US),  
ТИРОФФ-ЭКЕРДТ Рут (US),  
ЭФТИМИОПОУЛОС Константино (CH)**(54) КОМПОЗИЦИИ ПАНКРЕАТИЧЕСКИХ ФЕРМЕНТОВ И СПОСОБЫ ЛЕЧЕНИЯ  
ПАНКРЕАТИТА И НЕДОСТАТОЧНОСТИ ПОДЖЕЛУДОЧНОЙ ЖЕЛЕЗЫ****(57) Формула изобретения**

1. Композиция пищеварительных ферментов из множества частиц (multi-particulate), содержащая покрытые энтеросолюбильной оболочкой гранулы, содержащие пищеварительный фермент, и непокрытые оболочкой гранулы, содержащие пищеварительный фермент, где:

покрытые энтеросолюбильной оболочкой гранулы, содержащие пищеварительный фермент, содержат ядро и энтеросолюбильную оболочку, расположенную на ядре, где ядро содержит терапевтически эффективное количество липазы, и энтеросолюбильная оболочка содержит энтеросолюбильный полимер; и

непокрытые оболочкой гранулы, содержащие пищеварительный фермент, содержат терапевтически эффективное количество протеазы и по существу не содержат энтеросолюбильную полимерную оболочку;

где липазная активность покрытых оболочкой гранул находится в диапазоне от примерно 1000 USP (Фармакопея США) единиц до примерно 10000 USP единиц, и протеазная активность в непокрытых оболочкой гранулах находится в диапазоне от примерно 65000 USP единиц до примерно 34000 USP единиц.

2. Композиция пищеварительных ферментов из множества частиц по п.1, где липазная активность покрытых оболочкой гранул находится в диапазоне от примерно 1000 USP единиц до примерно 5000 USP единиц.

3. Композиция пищеварительных ферментов из множества частиц по п.1, где липазная

активность покрытых оболочкой гранул находится в диапазоне от примерно 2000 USP единиц до примерно 4000 USP единиц.

4. Композиция пищеварительных ферментов из множества частиц по п.1, где: каждая из покрытых энтеросолюбильной оболочкой и непокрытых оболочкой гранул, содержащих пищеварительный фермент, содержит липазу и протеазу и обладает по существу одинаковой протеазной и липазной активностью;

отношение липазной активности в покрытых энтеросолюбильной оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, к липазной активности в непокрытых оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, находится в диапазоне от примерно 95:5 до примерно 50:50; и

отношение протеазной активности в покрытых энтеросолюбильной оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, к протеазной активности в непокрытых оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, находится в диапазоне от примерно 5:95 до примерно 50:50.

5. Композиции пищеварительных ферментов из множества частиц по п.2, где: отношение липазной активности в покрытых энтеросолюбильной оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, к липазной активности в непокрытых оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, находится в диапазоне от примерно 95:5 до примерно 75:25; и

отношение протеазной активности в покрытых энтеросолюбильной оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, к протеазной активности в непокрытых оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, находится в диапазоне от примерно 5:95 до примерно 25:75.

6. Лекарственная форма, содержащая композицию пищеварительных ферментов из множества частиц по п.1.

7. Лекарственная форма по п.6, где непокрытые оболочкой гранулы, содержащие пищеварительный фермент, обладают общей протеазной активностью, находящейся в диапазоне от примерно 34000 USP единиц протеазы до примерно 62000 USP единиц протеазы.

8. Лекарственная форма по п.6, где непокрытые оболочкой гранулы, содержащие пищеварительный фермент, обладают общей протеазной активностью, находящейся в диапазоне от примерно 47000 USP единиц протеазы до примерно 62000 USP единиц протеазы.

9. Лекарственная форма по п.6 в форме капсулы, заполненной композицией пищеварительных ферментов из множества частиц.

10. Способ лечения боли при панкреатите, включающий введение композиции по п.1 пациенту, нуждающемуся в таком введении.

11. Способ лечения боли при панкреатите и недостаточности поджелудочной железы, включающий введение композиции по п.1 пациенту, нуждающемуся в таком введении.

12. Способ по п.11, где указанное введение включает введение такого количества композиции пищеварительных ферментов из множества частиц на один прием пищи, что липазная активность в покрытых энтеросолюбильной оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, находится в диапазоне от примерно 1000 до примерно 5000 USP единиц липазы.

13. Способ лечения экзокринной недостаточности поджелудочной железы, включающий введение пациенту, нуждающемуся в таком введении, терапевтически эффективной дозы композиции из множества частиц по п.1, где количество покрытых энтеросолюбильной оболочкой гранул, содержащих пищеварительный фермент, в указанной терапевтически эффективной дозе находится в диапазоне от примерно 100 до примерно 300 USP единиц липазы/кг/прием пищи.

14. Способ по п.13, где суточная доза липазы в покрытых энтеросолюбильной оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, находится в диапазоне от примерно 35000 до примерно 90000 USP единиц липазы.

15. Способ лечения панкреатической боли, включающий введение композиции по п.1 пациенту, нуждающемуся в таком введении.

16. Способ по п.15, где указанное введение включает введение такого количества композиции пищеварительных ферментов из множества частиц на один прием пищи, что протеазная активность в непокрытых оболочкой гранулах, содержащих пищеварительный фермент, находится в диапазоне от примерно 130000 до примерно 260000 USP единиц протеазы.

R U 2 0 1 2 1 1 3 2 5 3 A

R U 2 0 1 2 1 1 3 2 5 3 A