

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012109614/15, 17.06.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

18.09.2009 KR 10-2009-0088480

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

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 18.04.2012

(86) Заявка РСТ:

KR 2010/003920 (17.06.2010)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2011/034274 (24.03.2011)

Адрес для переписки:

125009, Москва, а/я 332, ЗАО "Инэврика"

(71) Заявитель(и):

**ХАНЛИМ ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО.,
ЛТД. (KR)**

(72) Автор(ы):

**КИМ Чин-Сон (KR),
ЛИ Кын-Хёк (KR),
ЧХВЕ Бён-Сон (KR),
КИМ Чжэ-Син (KR),
ПАК Чин-Ха (KR),
О Ми-Чин (KR),
КИМ Ын-Ми (KR)**(54) **ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ, СОДЕРЖАЩИЕ ПРОИЗВОДНЫЕ БИСФОСФОНАТА
И ВЫСОКИЕ ДОЗЫ ХОЛЕКАЛЬЦИФЕРОЛА**

(57) Формула изобретения

1. Фармацевтическая композиция для профилактики или лечения остеопороза, принимаемая один раз в месяц и содержащая ризедроновую кислоту или ее соль или ибандроновую кислоту или ее соль и холекальциферол в количестве, соответствующем 24000-50000 МЕ в единичной лекарственной форме.

2. Фармацевтическая композиция по п.1, в которой холекальциферол присутствует в количестве, соответствующем 30000 МЕ.

3. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, в которой единичная лекарственная форма представляет собой форму таблетки.

4. Фармацевтическая композиция для профилактики или лечения остеопороза, принимаемая один раз в месяц и содержащая:

(а) холекальциферолсодержащие гранулы, полученные адсорбцией на микрокристаллической целлюлозе раствора, полученного растворением в этаноле или в водном растворе этанола (i) холекальциферола в количестве, соответствующем 24000-50000 МЕ; (ii) одного или более компонентов, выбранных из токоферола ацетата, бутилгидрокситолуола и бутилгидроксизанола, в качестве первого стабилизатора; и (iii) связующего,

(b) маннит в качестве второго стабилизатора, и

(с) ризедроновую кислоту или ее соль или ибандроновую кислоту или ее соль.

5. Фармацевтическая композиция по п.4, в которой холекальциферол присутствует

в количестве, соответствующем 30000 МЕ.

6. Фармацевтическая композиция по п.4, в которой холекальциферолсодержащие гранулы получают путем осуществления процесса гранулирования, содержащим: перемешивание раствора, полученного растворением холекальциферола, первого стабилизатора и связующего в этаноле или в водном растворе этанола, с микрокристаллической целлюлозой в смесителе для получения пульпы и последующее высушивание и измельчение пульпы.

7. Фармацевтическая композиция по п.4, в которой первый стабилизатор представляет собой смесь токоферола ацетата и бутилгидрокситолуола.

8. Фармацевтическая композиция по п.7, в которой массовое соотношение токоферола ацетата и бутилгидрокситолуола находится в диапазоне 1: 0,2-1,0.

9. Фармацевтическая композиция по п.4, в которой первый стабилизатор присутствует в количестве от 0,4 до 2,0 мас.частей на одну массовую часть холекальциферола.

10. Фармацевтическая композиция по п.4, в которой связующее представляет собой гидроксипропилцеллюлозу.

11. Фармацевтическая композиция по любому из п.п.4-10, в которой маннит присутствует в количестве от 5 до 20 мас.% в расчете на общую массу фармацевтической композиции.

12. Фармацевтическая композиция по любому из п.п.4-10, дополнительно содержащая одно или более разрыхляющих веществ, выбранных из группы, состоящей из кросповидона, натриевой соли гликолята крахмала, натрийкарбоксиметилцеллюлозы и альгиновой кислоты; и одно или более скользящих веществ, выбранных из группы, состоящей из стеарата магния, стеариновой кислоты, талька и диоксида кремния.

13. Фармацевтическая композиция по любому из п.п.4-10, в которой лекарственная форма фармацевтической композиции является формой таблетки.

14. Фармацевтическая композиция по п.13, дополнительно содержащая пленочный покровный слой, содержащий смесь гидроксипропилметилцеллюлозы и полиэтиленгликоля.

15. Фармацевтическая композиция по п.14, в которой массовое соотношение гидроксипропилметилцеллюлозы и полиэтиленгликоля находится в диапазоне 5-15: 1.

16. Фармацевтическая композиция по п.4, в которой фармацевтическая композиция находится в форме таблетки, состоящей из (а) холекальциферолсодержащих гранул, содержащих 0,75 мг порошка холекальциферола (40000 МЕ/мг), 0,5 мг бутилгидрокситолуола, 0,9 мг токоферола ацетата, 6 мг гидроксипропилцеллюлозы и 40 мг микрокристаллической целлюлозы, (b) 40,0 мг маннита, (с) 150 мг натрия ризедроната или 150 мг натрия ибандроната и (d) 4 мг кросповидона и 4 мг стеарата магния.

17. Фармацевтическая композиция по п.16, в которой фармацевтическая композиция имеет форму покрытой пленкой таблетки, дополнительно содержащей пленочный покровный слой, состоящий из 5,1 мг гидроксипропилметилцеллюлозы, 0,51 мг полиэтиленгликоля 6000 (PEG 6000), 1,28 мг оксида титана и 0,11 мг талька на таблетку.