



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
 ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: **2004123623/15**, **28.01.2003**

(30) Приоритет: **01.02.2002 US 60/353,151**

(43) Дата публикации заявки: **20.04.2005 Бюл. № 11**

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: **30.07.2004**

(86) Заявка РСТ:  
**IB 03/00265 (28.01.2003)**

(87) Публикация РСТ:  
**WO 03/06382 (07.08.2003)**

Адрес для переписки:  
**129010, Москва, ул. Б.Спаская, 25, стр.3, ООО  
 "Юридическая фирма Городисский и Партнеры",  
 пат.пов. Г.Б. Егоровой**

(71) Заявитель(и):  
**ПФАЙЗЕР ПРОДАКТС ИНК. (US)**

(72) Автор(ы):  
**БИЛЛОТ Анн Мартин (US),  
 КЭРРИЕР Ребекка Лин (US),  
 ФЕРДЖИОНЕ Майкл Брюс (US),  
 МИЛЛЕР Ли Энтони (US),  
 РОЙ Майкл Кристофер (US),  
 ШАМБЛИН Шери Линн (US),  
 УОТЕРМАН Кеннет Крейг (US),  
 МАКДОНАЛЬД Брюс Клинтон (US),  
 ФРИЗЕН Дуэйн Томас (US)**

(74) Патентный поверенный:  
**Егорова Галина Борисовна**

(54) **СИСТЕМЫ ОСМОТИЧЕСКОЙ ДОСТАВКИ**

Формула изобретения

1. Осмотическая фармацевтическая таблетка, содержащая:
  - (a) однослойное прессованное ядро, включающее:
    - (i) не созревающее лекарство, имеющее растворимость на дозу менее около  $1 \text{ мл}^{-1}$ ,
    - (ii) гидроксиэтилцеллюлозу, имеющую средневесовую молекулярную массу от около 300000 до около 2000000, и
    - (iii) осмотический агент,
 где указанная гидроксиэтилцеллюлоза присутствует в указанном ядре в количестве от около 2,0 до около 20 мас.% и осмотический агент присутствует в количестве от около 15 до около 75 мас.%,
  - (b) водонепроницаемый слой вокруг указанного ядра; и
  - (c) по меньшей мере, один канал внутри указанного слоя (b) для доставки указанного лекарства в жидкую среду, окружающую указанную таблетку.
2. Осмотическая таблетка по п.1, где указанная гидроксиэтилцеллюлоза имеет средневесовую молекулярную массу от 700000 до 1500000.
3. Осмотическая таблетка по п.2, где указанная гидроксиэтилцеллюлоза присутствует в указанном ядре в количестве от около 3 до около 15 мас.%.
4. Осмотическая таблетка по п.1, где указанный осмотический агент, присутствующий в указанном ядре, является сахаром.
5. Осмотическая таблетка по п.4, где указанный сахар является сорбитом.
6. Осмотическая таблетка по п.1, где комбинация указанного не созревающего лекарства и указанного осмотического агента имеет среднюю пластичность от около 100 до около 200 МПа.

7. Осмотическая таблетка по п.1, где комбинация указанного не созревающего лекарства и указанного осмотического агента имеет среднюю прочность на растяжение от около 0,8 до около 2,0 МПа.

8. Осмотическая таблетка по п.1, где комбинация указанного не созревающего лекарства и указанного осмотического агента имеет средний показатель хрупкого разрушения менее примерно 0,2.

9. Осмотическая таблетка по п.1, которая дополнительно включает агент, модифицирующий рН, присутствующий в указанной таблетке в количестве от около 5 до около 25 мас. %.

10. Осмотическая таблетка по п.9, где указанный агент, модифицирующий рН, используемый в комбинации с не созревающим основным лекарством, выбран из группы, включающей винную кислоту, адипиновую кислоту, аскорбиновую кислоту, бензойную кислоту, лимонную кислоту, фумаровую кислоту, глутаминовую кислоту, яблочную кислоту, сорбиновую кислоту и толуолсульфоновую кислоту.

11. Осмотическая таблетка по п.9, где такая таблетка имеет соотношение площади поверхности к объему больше  $0,6 \text{ мм}^{-1}$ .

12. Осмотическая таблетка по п.1, где указанная таблетка имеет продолговатую форму, так что соотношение большей оси к меньшей оси составляет от 1,3 до 3.

13. Осмотическая таблетка по п.1, где указанная таблетка имеет форму каплеты, так что соотношение большей оси к меньшей оси составляет от 1,3 до 3.

14. Осмотическая таблетка по п.12 или 13, имеющая также единственное отверстие, полученное в пределах 3 мм от пересечения большей оси и внешнего обода таблетки.

15. Осмотическая таблетка по п.1, где, указанное не созревающее лекарство составляет, по меньшей мере, 30 мас. % указанного ядра таблетки.