



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
 ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: **2004108219/15**, **27.09.2002**

(30) Приоритет: **28.09.2001 IN 941/MUM/2001**
28.09.2001 IN 942/MUM/2001

(43) Дата публикации заявки: **10.03.2005 Бюл. № 7**

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
 фазу: **28.04.2004**

(86) Заявка РСТ:
IN 02/00194 (27.09.2002)

(87) Публикация РСТ:
WO 03/02663 (03.04.2003)

Адрес для переписки:
107023, Москва, ул. Б.Семеновская, 49, оф.404,
Фирма патентных поверенных ООО "ИННОТЭК",
пат.пов. О.В.Аргасов

(71) Заявитель(и):

САН ФАРМАСЬЮТИКЛ ИНДАСТРИЗ ЛИМИТИД
(IN)

(72) Автор(ы):

ТЬЕБДЖИ Зиауддин З. (IN),
РЕДДИ Харивардхан Л. (IN)

(74) Патентный поверенный:

Аргасов Олег Вячеславович

(54) **ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ САХАРНОГО ДИАБЕТА**

Формула изобретения

1. Лекарственная форма для лечения сахарного диабета и связанных с ним состояний, содержащая прессуемую композицию сердцевины с регулируемым высвобождением, содержащую метформин или его фармацевтически приемлемую соль, два или более набухаемых полимеров, в которых, по меньшей мере, один полимер является анионным полимером, один или несколько фармацевтически приемлемых эксципиентов, которые улучшают прессуемость композиции сердцевины, и, необязательно, покрытие, содержащее один или несколько водонерастворимых полимеров, окружающее сердцевину.

2. Лекарственная форма по п.1, дополнительно содержащая композицию с немедленным высвобождением длительно действующей сульфонилмочевины.

3. Лекарственная форма по п.2, где сульфонилмочевина длительного действия выбрана из группы, состоящей из карбутамида, хлорпропамида, глибурида (глибенкламида), глимепирида, гликлазида, глиборнурида, глигексамида, фенбутамида, толазамида, толбутамида и толцикламида.

4. Лекарственная форма по п.2, где сульфонилмочевинной длительного действия является глимепирид.

5. Лекарственная форма по п.1, где количество метформина или его фармацевтически приемлемой соли составляет приблизительно от 500 до приблизительно 1000 мг на лекарственную форму.

6. Лекарственная форма по п.1, где набухаемым полимером является сорт производного целлюлозы с высокой вязкостью.

7. Лекарственная форма по п.6, где производным целлюлозы является

гидроксипропилметилцеллюлоза (HPMC).

8. Лекарственная форма по п.7, где 2% (масс./масс.) водный раствор гидроксипропилметилцеллюлозы имеет вязкость в диапазоне от приблизительно 80000 до приблизительно 120000 сП.

9. Лекарственная форма по п.8, где сортом HPMC с высокой вязкостью является метоцел® K100M.

10. Лекарственная форма по п.1, где набухаемым полимером является смесь сорта HPMC с высокой вязкостью, имеющего вязкость выше, чем приблизительно 10000 сП для 2% (масс./масс.) водного раствора, и сорта HPMC с низкой вязкостью, имеющего вязкость, равную или ниже, чем приблизительно 10000 сП для 2% (масс./масс.) водного раствора.

11. Лекарственная форма по п.10, где сорт HPMC с высокой вязкостью имеет вязкость приблизительно 100000 сП для 2% (масс./масс.) водного раствора, и сорт HPMC с низкой вязкостью имеет вязкость приблизительно 4000 сП для 2% (масс./масс.) водного раствора.

12. Лекарственная форма по п.11, где сортом HPMC с высокой вязкостью является метоцел® K100M и сортом HPMC с низкой вязкостью является метоцел® K4M.

13. Лекарственная форма по п.1, где анионный полимер выбран из группы полиакриловой кислоты или ксантановой камеди или их смесей.

14. Лекарственная форма по п.1, где концентрация набухаемых полимеров составляет приблизительно от 15 до 40% общей массы указанной лекарственной формы.

15. Лекарственная форма по п.1, где эксципиент(ы), который улучшает прессуемость композиции сердцевины, выбран из группы, состоящей из микрокристаллической целлюлозы, порошкообразной целлюлозы, силицифированной микрокристаллической целлюлозы, декстринов и декстранов, коллоидного диоксида кремния, каолина, диоксида титана, плавленного диоксида кремния, оксида алюминия, бентонита, силиката магния, трисиликата магния, безводного сульфата кальция, смешанного силиката магния и алюминия и тому подобное.

16. Лекарственная форма по п.15, где эксципиентом является микрокристаллическая целлюлоза.

17. Лекарственная форма по п.1, дополнительно содержащая эксципиент(ы), который модулирует скорость высвобождения метформина из сердцевины и который выбран из группы, состоящей из осмогенов, слабых кислот и слабых оснований, поверхностно-активных веществ и тому подобное.

18. Лекарственная форма по п.17, где осмоген представляет собой хлорид натрия.

19. Лекарственная форма по п.17, где слабое основание представляет собой бикарбонат натрия.

20. Лекарственная форма для лечения сахарного диабета и связанных с ним состояний, содержащая композицию с немедленным высвобождением, содержащую сульфонилмочевину длительного действия, и композицию регулируемого высвобождения, содержащую бигуанид.

21. Лекарственная форма по п.20, где сульфонилмочевинной длительного действия является глимепирид.

22. Лекарственная форма по п.20, где бигуанид представляет собой метформин или его фармацевтически приемлемые соли.

23. Лекарственная форма по п.21, где количество глимепирида составляет 1,0 мг.

24. Лекарственная форма по п.22, где количество метформина составляет 500,0 мг в форме его основания или его фармацевтически приемлемой соли.