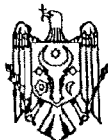


# REPUBLICA MOLDOVA



(19) Agenția de Stat  
pentru Proprietatea Intelectuală

(51) Int.Cl: A61K 31/7048 (2006.01)  
A61P 31/04 (2006.01)

## (12) CERERE DE BREVET DE INVENȚIE

<p>(21) Nr. depozit: a 2016 0131</p> <p>(22) Data depozit: 2015.05.11</p> <p>(31) Nr.: 14 075 031.6</p> <p>(32) Data: 2014.05.09</p> <p>(33) Țara: EP</p> <p>(41) Data publicării cererii: 2017.05.31, BOPI nr. 5/2017</p>	<p>(13) A2</p> <p>(85) Data deschiderii fazei naționale în conformitate cu PCT, 2016.11.24</p> <p>(86) Cerere internațională PCT: PCT/EP2015/000965, 2015.05.11</p> <p>(87) Publicare internațională: WO 2015/169451 A1, 2015.11.12</p>
<p>(71) Solicitant: ASTELLAS PHARMA EUROPE LTD, GB</p> <p>(72) Inventatori: KARAS Andreas Johannis, NL; LONGSHAW Christopher Mark, NL</p> <p>(74) Mandatar autorizat: GLAZUNOV Nicolae</p>	

### (54) Compus de tiacumicină și regim de tratament asociat

#### (57) Rezumat:

1

Se propune un compus al tiacumicinei, un stereoizomer al acesteia, un polimorf al acesteia sau un solvat farmaceutic acceptabil al acesteia și o compoziție farmaceutică, ce conține un compus al tiacumicinei, un stereoizomer al acesteia, un polimorf al acesteia sau un solvat farmaceutic acceptabil al acesteia utilizate în tratamentul oral al infecțiilor provocate de *Clostridium difficile* (CDI) sau diareii, sau bolii asociate cu *Clostridium difficile* (CDAD) la pacient în conformitate cu un regim de dozare selectat din grupul ce constă: i - administrarea a 200 mg de compus tiacumicinic BID, timp de 5 zile, urmate de 5 zile de repaos, apoi 200 mg odată pe zi pentru următoarele 10 zile și ii - administrarea a 200 mg de compus tiacumicinic BID, timp de 5 zile, urmate de o

2

singură doză de 200 mg peste o zi, timp de 20 zile.

De asemenea, se propune o metodă de restabilire a populației de bifidobacterii din intestin la pacientul care suferă de infecții provocate de *Clostridium difficile* (CDI) sau diaree, sau boli asociate cu *Clostridium difficile* (CDAD) și care primește tratament oral cu un compus al tiacumicinei, de la 50% până la 90% din populația de bifidobacterii din intestin cu administrarea compusului tiacumicinic, timp de 15..45 zile de la începutul tratamentului, prin administrarea orală a compusului tiacumicinic la pacient în conformitate cu regimul de dozare, care este selectat din grupul menționat mai sus.

Revendicări: 21

Figuri: 50

Șef Secție Examinare:

LEVIȚCHI Svetlana

Examinator:

GROSU Petru

Redactor:

LOZOVANU Maria

**(54) Tiacumicin compound and associated treatment regimen****(57) Abstract:**

1  
A tiacumicin compound, a stereo-isomer thereof, a polymorph thereof or a pharmaceutically acceptable solvate thereof, and a pharmaceutical composition, containing a tiacumicin compound, a stereo-isomer thereof, a polymorph thereof or a pharmaceutically acceptable solvate thereof, are provided for use in the oral treatment of *Clostridium difficile* infections (CDI) or *Clostridium difficile* associated diarrhea or disease (CDAD) in a patient in accordance with a dosage regimen selected from the group consisting of: i. Administering 200 mg of the tiacumicin compound BID for 5 days followed by 5 days of rest and then 200 mg once daily for a further 10 days and ii. Administering 200 mg of the tiacumicin compound BID for 5 days

2  
followed by a single 200 mg every other day for 20 days.

Further, a method is provided for recovering of gut Bifidobacteria population in a patient, suffering from *Clostridium difficile* infections (CDI) or *Clostridium difficile* associated diarrhea or disease (CDAD) and receiving oral treatment with a tiacumicin compound, from 50 to 90% of the gut Bifidobacteria population prior to administering the tiacumicin compound during days 15-45 after start of the treatment by orally administering the tiacumicin compound to the patient according to a dosage regimen, which is selected from the above-mentioned group.

Claims: 21

Fig.: 50

**(54) Тиакумициновое соединение и ассоциированный режим лечения****(57) Реферат:**

1  
Предложено тиакумициновое соединение, его стереоизомер, его полиморф или его фармацевтически приемлемый сольват и фармацевтическая композиция, содержащая тиакумициновое соединение, его стереоизомер, его полиморф или его фармацевтически приемлемый сольват для перорального лечения инфекций вызванных *Clostridium difficile* (CDI) или диареи, или заболевания ассоциированной с *Clostridium difficile* (CD AD) у пациента в соответствии со схемой дозирования, выбранной из группы, состоящей из: i - введения 200 мг тиакумицинового соединения BID в течение 5-и суток, с последующими 5-и сутками перерыва, затем 200 мг один раз в сутки, в течение следующих 10 суток и ii - введения 200 мг тиакумицинового соединения BID в течение 5-и суток с

2  
последующими однократными 200 мг через сутки, в течение 20 суток.

Также, предложен способ восстановления популяции бифидобактерий кишечника у пациента, страдающего инфекциями вызванными *Clostridium difficile* (CDI) или диареи, или заболеванием ассоциированной с *Clostridium difficile* (CD AD) и получающего пероральное лечение тиакумициновым соединением, от 50% до 90% популяции бифидобактерий кишечника тиакумицинового соединения в течение 15...45 суток после начала лечения посредством перорального введения тиакумицинового соединения пациенту в соответствии со схемой лечения, выбранной из вышеуказанной группы.

П. формулы: 21

Фиг.: 50