



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2005134364/14, 08.04.2004

(30) Конвенционный приоритет:
08.04.2003 US 60/461,585

(43) Дата публикации заявки: 10.06.2006 Бюл. № 16

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 08.11.2005

(86) Заявка РСТ:
US 2004/010998 (08.04.2004)

(87) Публикация РСТ:
WO 2004/091665 (28.10.2004)

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

(71) Заявитель(и):
ПРОДЖИНИКС ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ИНК. (US)

(72) Автор(ы):
САНГХВИ Сукету П. (US),
БОЙД Томас А. (US),
МАДДОН Пол Дж. (US)

(74) Патентный поверенный:
Егорова Галина Борисовна

(54) КОМБИНИРОВАННОЕ ЛЕЧЕНИЕ ЗАПОРА

(57) Формула изобретения

1. Способ лечения запора, включающий введение пациенту, нуждающемуся в подобном лечении, слабительного средства и периферического опиоидного антагониста в количествах, эффективных для лечения запора.

2. Способ по п.1, где пациент не поддается лечению с помощью слабительных средств.

3. Способ по п.1, который дополнительно включает введение пациенту опиоида.

4. Способ по п.1, где пациент получает опиоид постоянно.

5. Способ по п.3, где опиоидом является морфин.

6. Способ по п.1, где периферический опиоидный антагонист и слабительное средство вводят в одной препаративной форме.

7. Способ лечения запора, включающий введение пациенту, нуждающемуся в подобном лечении, размягчителя стула и периферического опиоидного антагониста в количествах, эффективных для лечения запора.

8. Способ по п.7, где пациент не поддается лечению с помощью размягчителя стула.

9. Способ по п.7, который дополнительно включает введение пациенту опиоида.

10. Способ по п.9, где опиоид назначают постоянно.

11. Способ по п.9, где опиоидом является морфин.

12. Способ по п.7, где периферический опиоидный антагонист и размягчитель стула вводят в одном составе.

13. Способ лечения состояния, требующего лечения с применением слабительного средства, который включает введение пациенту, нуждающемуся в подобном лечении,

слабительного средства и периферического опиоидного антагониста в количествах, эффективных для лечения указанного состояния.

14. Способ по п.13, где пациент не поддается лечению с помощью слабительных средств.

15. Способ по п.13, который дополнительно включает введение пациенту опиоида.

16. Способ по п.15, где опиоид назначают постоянно.

17. Способ по п.15, где опиоидом является морфин.

18. Способ по п.13, где периферический опиоидный антагонист и слабительное средство вводят в одной препаративной форме.

19. Способ лечения состояния, требующего лечения с применением размягчителя стула, который включает введение пациенту, нуждающемуся в подобном лечении, размягчителя стула и периферического опиоидного антагониста в количествах, эффективных для лечения указанного состояния.

20. Способ по п.19, где пациент не поддается лечению с помощью размягчителя стула.

21. Способ по п.19, который дополнительно включает введение пациенту опиоида.

22. Способ по п.21, где опиоид назначают постоянно.

23. Способ по п.21, где опиоидом является морфин.

24. Способ по п.19, где периферический опиоидный антагонист и размягчитель стула вводят в одной препаративной форме.

25. Способ по любому из пп.1-24, где периферическим опиоидным антагонистом является четвертичное производное нороксиморфона.

26. Способ по п.25, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон.

27. Способ по любому из пп.1-24, где пациентом является неизлечимо больной пациент.

28. Способ по п.27, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон.

29. Способ по любому из пп.1-24, где пациентом является пациент с прогрессирующим заболеванием.

30. Способ по п.29, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон.

31. Способ по любому из пп.1-24, где пациентом является больной раком.

32. Способ по п.31, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон.

33. Способ по любому из пп.1-24, где пациентом является послеоперационный пациент.

34. Способ по п.33, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон.

35. Способ по любому из пп.1-24, где пациент страдает от хронической боли.

36. Способ по п.35, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон.

37. Способ по любому из пп.1-24, где периферическим опиоидным антагонистом является четвертичное производное нороксиморфона, а пациенту вводят периферический опиоидный антагонист парентерально в количестве в интервале от 0,001 до 1,0 мг/кг.

38. Способ по п.37, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон, и где пациенту вводят метилналтрексон парентерально в количестве от 0,1 до 0,45 мг/кг.

39. Способ по п.38, где количество метилналтрексона составляет от 0,1 до 0,3 мг/кг.

40. Способ по п.38, где периферический опиоидный антагонист вводят парентерально.

41. Способ по п.40, где периферический опиоидный антагонист вводят путем, выбранным из группы, включающей внутривенное, подкожное введение или введение с помощью безыгольной инъекции.

42. Способ по любому из пп.1-24, где пациенту вводят периферический опиоидный антагонист перорально или ректально.

43. Способ по п.42, где периферическим опиоидным антагонистом является четвертичное производное нороксиморфона и периферический опиоидный антагонист

назначают в количестве от 10 до 500 мг/кг.

44. Способ по п.43, где периферический опиоидный антагонист назначают в виде препаративной формы с энтеросолюбильной оболочкой.

45. Способ по п.43, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон, и где пациенту вводят метилналтрексон перорально в количестве от 50 до 250 мг.

46. Способ по п.45, где количество метилналтрексона составляет от 75 до 225 мг.

47. Способ по любому из пп.1-24, где пациенту назначают периферический опиоидный антагонист ректально.

48. Препаративная форма, включающая периферический опиоидный антагонист и слабительное средство.

49. Препаративная форма по п.48, где периферический опиоидный антагонист и слабительное средство готовят в виде суппозитория.

50. Препаративная форма по п.49, где периферический опиоидный антагонист образует сердцевину суппозитория.

51. Препаративная форма по п.49, где периферический опиоидный антагонист распределен по всему объему суппозитория.

52. Препаративная форма по п.49, где периферический опиоидный антагонист покрывают фармацевтически приемлемым носителем.

53. Препаративная форма по п.49, где периферический опиоидный антагонист представляет собой частицы.

54. Препаративная форма по п.51, где частицы покрыты фармацевтически приемлемым носителем.

55. Препаративная форма по п.48, где препаративная форма представляет собой пероральную препаративную форму.

56. Препаративная форма по п.55, где периферический опиоидный антагонист образует сердцевину перорального препарата.

57. Препаративная форма по п.55, где периферический опиоидный антагонист распределен по всему объему пероральной препаративной формы.

58. Препаративная форма по п.55, где, по крайней мере, часть периферического опиоидного антагониста покрыта фармацевтически приемлемым носителем.

59. Препаративная форма по п.58, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой энтеросолюбильное покрытие.

60. Препаративная форма по п.59, где слабительное средство не имеет энтеросолюбильного покрытия.

61. Препаративная форма по п.55, где, по крайней мере, часть слабительного средства покрыта фармацевтически приемлемым носителем.

62. Препаративная форма по п.61, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой энтеросолюбильное покрытие.

63. Препаративная форма по п.62, где периферический опиоидный антагонист не имеет энтеросолюбильного покрытия.

64. Препаративная форма по п.55, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она высвобождала периферический опиоидный антагонист в желудке, в тонкой кишке и в толстой кишке.

65. Препаративная форма по п.55, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она высвобождала периферический опиоидный антагонист только в тонкой кишке и в толстой кишке.

66. Препаративная форма по п.55, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она высвобождала периферический опиоидный антагонист только в тонкой кишке.

67. Препаративная форма по п.55, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она высвобождала периферический опиоидный антагонист только в толстой кишке.

68. Препаративная форма по п.55, где препаративная форма разработана и

приготовлена таким образом, чтобы она сразу же высвобождала практически весь периферический опиоидный антагонист в желудке.

69. Препаративная форма по п.48, где периферический опиоидный антагонист находится внутри или покрыт материалом, обеспечивающим замедленное высвобождение.

70. Препаративная форма по п.48, где периферический опиоидный антагонист входит в состав материала, обеспечивающего замедленное высвобождение и покрытого энтеросолюбильной оболочкой.

71. Препаративная форма по п.69, где слабительное средство не входит в состав материала, обеспечивающего замедленное высвобождение.

72. Препаративная форма по п. 48, где слабительное средство находится внутри или покрыто материалом, обеспечивающим замедленное высвобождение.

73. Препаративная форма по п.72, где материал, обеспечивающий замедленное высвобождение, представляет собой матрицу или мембрану.

74. Препаративная форма по п.48, где слабительное средство представляет собой материал, обеспечивающий замедленное высвобождение и покрытое энтеросолюбильной оболочкой.

75. Препаративная форма по п.72, где периферический опиоидный антагонист не входит в состав материала, обеспечивающего замедленное высвобождение.

76. Препаративная форма по любому из пп.48-75, где периферическим опиоидным антагонистом является четвертичное производное нороксиморфона.

77. Препаративная форма по п.76, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон.

78. Препаративная форма по п.77, где метилналтрексон содержится в количестве от 50 до 250 мг.

79. Препаративная форма по п.77, где препаративная форма дополнительно включает опиоид.

80. Препаративная форма, включающая периферический опиоидный антагонист и размягчитель стула.

81. Препаративная форма по п.80, где опиоидный антагонист и размягчитель стула готовят в виде суппозитория.

82. Препаративная форма по п.80, где периферический опиоидный антагонист образует сердцевину суппозитория.

83. Препаративная форма по п.80, где периферический опиоидный антагонист распределен по всему объему суппозитория.

84. Препаративная форма по п.80, где периферический опиоидный антагонист покрывают фармацевтически приемлемым носителем.

85. Препаративная форма по п.80, где периферический опиоидный антагонист включает частицы.

86. Препаративная форма по п.85, где частицы покрыты фармацевтически приемлемым носителем.

87. Препаративная форма по п.80, где препаративная форма представляет собой пероральную препаративную форму.

88. Препаративная форма по п.87, где препаративная форма является жидкой, полутвердой или твердой.

89. Препаративная форма по п.87, где периферический опиоидный антагонист образует сердцевину перорального препарата.

90. Препаративная форма по п.87, где периферический опиоидный антагонист распределен по всему объему пероральной препаративной формы.

91. Препаративная форма по п.87, где, по крайней мере, часть периферического опиоидного антагониста покрыта фармацевтически приемлемым носителем.

92. Препаративная форма по п.91, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой энтеросолюбильное покрытие.

93. Препаративная форма по п.91, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой покрытие, обеспечивающее замедленное высвобождение.

94. Препаративная форма по п.93, где размягчитель стула не имеет энтеросолюбильного покрытия.

95. Препаративная форма по п.87, где, по крайней мере, часть размягчителя стула покрыта фармацевтически приемлемым носителем.

96. Препаративная форма по п.95, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой энтеросолюбильное покрытие.

97. Препаративная форма по п.95, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой покрытие, обеспечивающее замедленное высвобождение.

98. Препаративная форма по п.96, где периферический опиоидный антагонист не имеет энтеросолюбильного покрытия.

99. Препаративная форма по п.87, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она высвобождала периферический опиоидный антагонист в желудке, в тонкой кишке и в толстой кишке.

100. Препаративная форма по п.87, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она высвобождала периферический опиоидный антагонист в тонкой кишке и в толстой кишке.

101. Препаративная форма по п.87, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она высвобождала периферический опиоидный антагонист в тонкой кишке.

102. Препаративная форма по п.87, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она высвобождала периферический опиоидный антагонист только в толстой кишке.

103. Препаративная форма по п.87, где препаративная форма разработана и приготовлена таким образом, чтобы она сразу же высвобождала практически весь периферический опиоидный антагонист в желудке.

104. Препаративная форма по п.80, где периферический опиоидный антагонист входит в состав материала, обеспечивающего замедленное высвобождение.

105. Препаративная форма по п.104, где размягчитель стула не входит в состав материала, обеспечивающего замедленное высвобождение.

106. Препаративная форма по п.80, где размягчитель стула входит в состав материала, обеспечивающего замедленное высвобождение.

107. Препаративная форма по п.106, где периферический опиоидный антагонист не входит в состав материала, обеспечивающего замедленное высвобождение.

108. Препаративная форма по любому из пп.80-107, где периферическим опиоидным антагонистом является четвертичное производное нороксिमорфона.

109. Препаративная форма по п.108, где периферическим опиоидным антагонистом является метилналтрексон.

110. Препаративная форма по п.109, где метилналтрексон содержится в количестве от 50 до 250 мг.

111. Препаративная форма по п.110, где препаративная форма дополнительно включает опиоид.

112. Набор, включающий упаковку, содержащую препаративную форму периферического опиоидного антагониста и слабительного средства и/или размягчителя стула.

113. Набор по п.112, где препаративная форма представляет собой препаративную форму по любому из пп.48-111.

114. Набор по п.112, где периферический опиоидный антагонист находится в первом контейнере, а слабительное средство и/или размягчитель стула находится в контейнере, отличном от первого контейнера.