



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012140421/15, 23.02.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
23.02.2010 EP 10305179.3

(43) Дата публикации заявки: 27.03.2014 Бюл. № 9

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 24.09.2012(86) Заявка РСТ:  
EP 2011/052682 (23.02.2011)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/104275 (01.09.2011)Адрес для переписки:  
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО  
"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

ДА ВОЛТЕРРА (FR)

(72) Автор(ы):

ЛЕСКЮР Франсуа (FR),  
ДЕ ГАНЗБУРГ Жан (GB)(54) **ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ФОРМЫ ДЛЯ ПЕРОРАЛЬНОЙ ДОСТАВКИ АДСОРБЕНТОВ В  
КИШЕЧНИК**

## (57) Формула изобретения

1. Композиция, содержащая адсорбент, смешанный с каррагенаном, предпочтительно в форме таблетки.

2. Композиция по п.1, где адсорбент - это активированный уголь.

3. Композиция по пп.1 или 2, где каррагенан - это каппа-каррагенан.

4. Композиция по пп.1 или 2, где количество каррагенана включает от 5% и 25%, более предпочтительно между 10% и 20% от веса композиции.

5. Композиция по п.3, где количество каррагенана включает от 5% и 25%, более предпочтительно между 10% и 20% от веса композиции.

6. Лекарственная форма, содержащая

- сердцевину, содержащую композицию по любому из пп.1-4, и

- слой наружного покрытия, образованного вокруг сердцевины, так что адсорбент высвобождается из формы в требуемом отделе кишечника.

7. Форма по п.6, содержащая сердцевину, содержащую композицию по любому из пп.1-5, и слой наружного покрытия, образованного вокруг сердцевины, так что адсорбент высвобождается из формы в нижнем отделе кишечника

8. Форма по п.7, где наружное покрытие является рН-зависимым кишечнорастворимым полимером.

9. Форма по п.8, где рН-зависимый кишечнорастворимый полимер выбран из группы, состоящей из ацетата тримеллитата целлюлезы (САТ), ацетата фталата целлюлезы

(САР), анионных кополимеров, основанных на метилакрilate, метилметакрилате и метакриловой кислоте, гидроксипропил фталат метилцеллюлозы (НРМСР), ацетат сукцинат гидроксипропилметилцеллюлозы (НРМСАС), сополимеров метакриловой кислоты и этил акрилата, кополимера метакриловой кислоты и этил акрилата, сополимеров метакриловой кислоты и метил акрилата, (отношение 1:1), кополимеров метакриловой кислоты и метил акрилата, (отношение 1:2), поливинил ацетат фталата (РВАР) и шеллачных смол.

10. Форма по пп.8 или 9, где полимер растворяется при рН, равном 6,0 и более.

11. Форма по п.10, где рН-зависимый полимер выбран из группы, включающей

- шеллак,

- ацетат сукцинат гидроксиметилцеллюлозу,

- анионные сополимеры, основанные на метил акрилате, метил метакрилате и метакриловой кислоте и

- метакриловой кислоте и метил метакрилате (отношение 1:2).

12. Форма по п.7, где наружное покрытие является смесью метил метакрилата и метакриловой кислоты и кополимера метакриловой кислоты и этил акрилата при отношении между 99:1 и 80:20.

13. Форма по любому из пп.7-9 и 11-12, где осуществлено дополнительное покрытие между сердцевинной и внешним рН-зависимым покрытием, причем упомянутое дополнительное покрытие, в частности, выбрано из группы, включающей

- рН-зависимые полимеры, в том числе, полимеры типа шеллака, анионные сополимеры, основанные на метилакрilate, метилметакрилате и метакриловой кислоте, сополимере метакриловой кислоты и этилакрilate, фталате гидроксипропил метилцеллюлозы (НРМСР), ацетатсукцинат гидроксипропилметилцеллюлозе (НРМСАС),

- рН-независимый водорастворимый полимер, такой как РVP или высокомолекулярные целлюлозные полимеры, такие как

гидроксипропилметилцеллюлоза (НРМС) или гидроксипропилцеллюлоза (НРС),

- рН-независимые водорастворимые полимеры, такие как полимеры этилцеллюлозы или сополимеры этилакрilate метилметакрилата,

- смеси рН-зависимого полимера и не растворимого в воде рН-независимого полимера, такого как этилцеллюлоза или сополимер этилакрilate метилметакрилата (NE30D).

14. Форма по п.13, где полимерный слой, который растворяется рН-независимым образом и содержит по меньшей мере одно производное целлюлозы, выбранное из группы, состоящей из гидроксипропилцеллюлозы или этилцеллюлозы.

15. Форма по п.13, где полимерный слой, который растворяется рН-независимым образом и составлен из 1:9 до 9:1, предпочтительно от 2:8 до 3:7, смеси сополимера метакриловой кислоты и сополимера этил акрилата и сополимера этил акрилата метилметакрилата.

16. Форма по п.7 для применения в методе устранения или уменьшения в кишечнике, в частности, в толстой кишке побочных эффектов фармацевтических агентов, вводимых для лечения заболеваний, но оказывающих повреждающее действие, когда они или их метаболиты и производные достигают нижнего отдела илеума, слепой кишки или толстой кишки.

17. Форма по п.16 для применения в методе устранения или уменьшения связанных с антибиотиками повреждающих эффектов антибиотических агентов, в частности, для устранения или уменьшения проявления устойчивости к антибиотикам или для устранения или уменьшения диареи.

18. Форма по п.17, где упомянутый антибиотик и упомянутую форму вводят одновременно оральным способом.

19. Форма по п.17, где упомянутый фармацевтический агент выбран в группе, включающей противоопухолевые агенты, например ингибиторы топоизомеразы I, такие как Иринотекан, противовоспалительные соединения или ингибиторы интерлейкина-1, такого как диасцерхеин, панкреалипаза, селективный ингибитор фосфодиэстеразы 4, используемые для лечения хронического обструктивного заболевания легких (COPD), такие как рофумиласт или циломиласт, обладающих противовоспалительными и антимиотическими активностями, такие как колхицины, иринотекан или их метаболиты, в частности SN-38.

20. Форма по п.7 для использования в методе устранения эффектов бактериальных или грибковых токсинов, таких как митотоксины, эндотоксины или энтеротоксины или образованных *Clostridium difficile* в кишечнике до того, как они достигают толстой кишки.

21. Форма по п.7 для использования в методе лечения, выбранного в группе, включающей хроническое заболевания почек, (СКД), воспалительные кишечные заболевания (IBDs), в частности язвенный колит или болезнь Крона и печеночная энцефалопатия.

22 Форма по п.7 для использования в методе устранения или уменьшения количества AGEs, фенолов (например, п-крезилсульфата), индолов (например, индоксил сульфата), оксида азота, радикалов кислорода, простагландинов, лейкотриенов, гистамина, протеаз, матриксных металлопротеиназ или азотистыми соединениями, а именно, аммония в нижнем отделе кишечника.

23. Применение формы по пп.7-15 для снижения метеоризма, неприятного запаха стула, неприятного запаха изо рта или непереносимости пищи, в частности, у домашних или сельскохозяйственных животных.

RU 2012140421 A

RU 2012140421 A