



(51) МПК  
*A61K 9/20* (2006.01)  
*A61K 9/22* (2006.01)  
*A61K 9/32* (2006.01)  
*A61K 47/36* (2006.01)  
*A61K 33/44* (2006.01)  
*A61P 13/12* (2006.01)  
*A61P 1/06* (2006.01)  
*A61P 1/16* (2006.01)

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2016147198, 01.12.2016

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
23.02.2010 EP 10305179.3(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,  
из которой данная заявка выделена: 2012140421  
21.09.2012

(43) Дата публикации заявки: 01.06.2018 Бюл. № 16

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. Лекарственная форма для пероральной доставки активированного древесного угля в кишечник, содержащая:

- сердцевину, включающую композицию, содержащую активированный древесный уголь, смешанный с каррагенаном, предпочтительно в форме таблетки, и
- слой наружного покрытия, образованного вокруг сердцевины, так что активированный древесный уголь высвобождается из формы в требуемом отделе кишечника.

2. Лекарственная форма по п. 1, где каррагенан представляет собой каппа-каррагенан.

3. Лекарственная форма по п. 1 или 2, где количество каррагенана включает от 5% и 25%, более предпочтительно, между 10 и 20% от веса композиции.

4. Лекарственная форма по п. 1, где наружное покрытие является рН-зависимым кишечнорастворимым полимером.

5. Лекарственная форма по п. 4, где рН-зависимый кишечнорастворимый полимер выбран из группы, состоящей из ацетата тримеллитата целлюлозы (САТ), ацетата фталата целлюлозы (САР), анионных сополимеров на основе метилакрилата, метилметакрилата и метакриловой кислоты, гидроксипропилфталатметилцеллюлозы (НРМСР), ацетатсукцинатгидроксипропилметилцеллюлозы (НРМСАС), сополимеров метакриловой кислоты и этилакрилата, сополимеров метакриловой кислоты и метилакрилата, (отношение 1:1), сополимеров метакриловой кислоты и метилакрилата, (отношение 1:2), поливинилацетатфталата (PVAR) и шеллачных смол.

6. Лекарственная форма по п. 4 или 5, где полимер растворяется при рН, равном 6,0 и более.

7. Лекарственная форма по п. 6, где рН-зависимый полимер выбран из группы, состоящей из:

- шеллака,
- ацетатсукцинатгидроксиметилцеллюлозы,
- талатгидроксипропилметилцеллюлозы,
- анионных сополимеров на основе метилакрилата, метилметакрилата и метакриловой кислоты, и
- сополимера метакриловой кислоты и метилметакрилата (соотношение 1:2).

8. Лекарственная форма по п. 1, где наружное покрытие является смесью метилметакрилата и метакриловой кислоты и сополимера метакриловой кислоты и этилакрилата при отношении между 99:1 и 80:20.

9. Лекарственная форма по любому из пп. 1-5 и 7-8, где осуществлено дополнительное покрытие между сердцевинной и внешним рН-зависимым покрытием, причем упомянутое дополнительное покрытие, в частности, выбрано из группы, состоящей из

- рН-зависимых полимеров, в том числе, полимеров типа шеллака, анионных сополимеров на основе метилакрилата, метилметакрилата и метакриловой кислоты, сополимера метакриловой кислоты и этилакрилата, фталатгидроксипропилметилцеллюлозы (НРМСР), ацетатсукцинатгидроксипропилметилцеллюлозы (НРМСАС),
- рН-независимого водорастворимого полимера, такого как РVP или высокомолекулярных целлюлезных полимеров, таких как гидроксипропилметилцеллюлоза (НРМС) или гидроксипропилцеллюлоза (НРС),
- рН-независимых водорастворимых полимеров, таких как полимеры этилцеллюлозы или сополимеры этилакрилатметилметакрилата,
- смеси рН-зависимого полимера и не растворимого в воде рН-независимого полимера, такого как этилцеллюлоза или сополимер этилакрилатметилметакрилата (NE30D).

10. Лекарственная форма по п. 9, где полимерный слой, который растворяется рН-независимым образом, и содержит по меньшей мере одно производное целлюлозы, выбранное из группы, состоящей из гидроксипропилцеллюлозы или этилцеллюлозы.

11. Лекарственная форма по п. 9, 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.

12. Лекарственная форма по п. 1, 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.

13. Лекарственная форма по п. 12 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.

14. Лекарственная форма по п. 13, где упомянутый антибиотик и упомянутую форму вводят одновременно оральным способом.

15. Лекарственная форма по п. 12, 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.

16. Лекарственная форма по п. 1 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.

17. Лекарственная форма по п. 1 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.

18. Лекарственная форма по п. 1 для использования в методе устранения или уменьшения количества AGE, 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.

19. Применение формы по пп. 1-11 для снижения метеоризма, неприятного запаха стула, неприятного запаха изо рта или непереносимости пищи, в частности, у домашних или сельскохозяйственных животных.

A 8 6 1 7 4 1 9 1 0 2 R U

R U 2 0 1 6 1 4 7 1 9 8 A