

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2015128794, 19.12.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

20.12.2012 US 61/739,813;

04.01.2013 US 61/749,040

(43) Дата публикации заявки: 25.01.2017 Бюл. № 03

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 20.07.2015

(86) Заявка РСТ:

US 2013/076578 (19.12.2013)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2014/100418 (26.06.2014)

Адрес для переписки:

191002, Санкт-Петербург, а/я 5, ООО "Ляпунов
и партнёры"

(71) Заявитель(и):

КАШИВ ФАРМА, ЭлЭлСи (US)

(72) Автор(ы):

ДЬОРДЬЕВИЦ Елена (US),**БОММАНА Мурали Мохан (US),****ФУАПРАДИТ Вангани (US),****ША Навнит Х. (US),****ПИЦЦО Кристофер А. (US)**(54) **КОМПОЗИЦИЯ ПЕРОРАЛЬНО РАСПАДАЮЩЕЙСЯ ТАБЛЕТКИ, ОБЕСПЕЧИВАЮЩАЯ
ПОВЫШЕННУЮ БИОДОСТУПНОСТЬ**(57) **Формула изобретения**

1. Композиция, содержащая твердую дисперсию слаборастворимого в воде лекарственного средства и ионного полимера, где ионный полимер присутствует в таком количестве, чтобы сохранять указанное слаборастворимое в воде лекарственное средство, по существу, в аморфной форме, при этом указанный ионный полимер присутствует в количестве по меньшей мере 45 мас.% от указанной композиции.

2. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что ионный полимер присутствует в количестве по меньшей мере приблизительно 50 мас.% от указанной композиции.

3. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что ионный полимер присутствует в количестве по меньшей мере приблизительно 65 мас.% от указанной композиции.

4. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что ионный полимер присутствует в количестве от приблизительно 55 мас.% до приблизительно 75 мас.% от указанной композиции.

5. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что полимер представляет собой анионный полимер.

6. Композиция по п. 5, отличающаяся тем, что анионный полимер представляет собой сополимер метакриловой кислоты и акрилата, выбранного из группы, состоящей из этилакрилата, метакрилата и метилметакрилата.

7. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что полимер представляет собой катионный

полимер.

8. Композиция по п. 7, отличающаяся тем, что катионный полимер основан на сополимере диметиламиноэтилметакрилата, бутилметакрилата и метилметакрилата.

9. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что полимер представляет собой смесь сложных эфиров уксусной кислоты и моноянтарной кислоты гидроксипропилметилцеллюлозы.

10. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что слаборастворимое в воде лекарственное средство присутствует в количестве от приблизительно 5 мас.% до приблизительно 75 мас.% от указанной композиции.

11. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что слаборастворимое в воде лекарственное средство присутствует в количестве от приблизительно 20 мас.% до приблизительно 50 мас.% от указанной композиции.

12. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что слаборастворимое в воде лекарственное средство присутствует в количестве от приблизительно 30 мас.% до приблизительно 50 мас.% от указанной композиции.

13. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что слаборастворимое в воде лекарственное средство выбирают из группы, состоящей из анальгетиков, снотворных средств, средств для лечения биполярного расстройства, средств для лечения шизофрении и средств для лечения центральной нервной системы.

14. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что слаборастворимое в воде лекарственное средство выбирают из группы, состоящей из мегестрола, зипрасидона, эзопиклона и суматриптана или их фармацевтически приемлемых кислот, солей или гидратов.

15. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что ионный полимер выбирают так, что дисперсия сохраняет температуру стеклования от приблизительно 50°C до приблизительно 150°C.

16. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что ионный полимер выбирают так, что дисперсия сохраняет температуру стеклования от приблизительно 50°C до приблизительно 120°C.

17. Композиция по п. 1, дополнительно содержащая по меньшей мере одну добавку, эксципиент или носитель.

18. Композиция по п. 17, отличающаяся тем, что по меньшей мере одну добавку, эксципиент или носитель выбирают из группы, состоящей из разбавителей, связующих веществ, стабилизаторов лекарственных средств, разрыхлителей, скользящих веществ, смазывающих веществ, модификаторов скорости высвобождения, антиоксидантов, покрытий, красящих веществ, подсластителей и вкусовых веществ.

19. Перорально распадающаяся таблетка, содержащая композицию по п. 1 и по меньшей мере одну фармацевтически приемлемую добавку, эксципиент или носитель.

20. Перорально распадающаяся таблетка по п. 19, отличающаяся тем, что средний размер частицы в дисперсии составляет от приблизительно 100 мкм до приблизительно 350 мкм.

21. Способ лечения субъекта, включающий введение композиции по п. 1, где указанную композицию объединяют с по меньшей мере одной фармацевтически приемлемой добавкой, эксципиентом или носителем.

22. Способ лечения субъекта, включающий введение перорально распадающейся таблетки по п. 19.

23. Композиция, содержащая твердую дисперсию мегестрола и ионного полимера, где ионный полимер присутствует в таком количестве, чтобы сохранять слаборастворимое в воде лекарственное средство по существу в аморфной форме, при этом ионный полимер присутствует в количестве по меньшей мере 65 масс. % от

указанной композиции.

24. Перорально распадающаяся таблетка, содержащая твердую дисперсию слаборастворимого в воде лекарственного средства и ионного полимера, где ионный полимер присутствует в таком количестве, чтобы сохранять слаборастворимое в воде лекарственное средство, по существу, в аморфной форме, при этом ионный полимер выбирают так, что таблетка распадается в течение приблизительно 30 с, при этом указанная таблетка дополнительно содержит по меньшей мере одну добавку, эксципиент или носитель.

25. Перорально распадающаяся таблетка по п. 24, отличающаяся тем, что слаборастворимое в воде лекарственное средство представляет собой мегестрол или его фармацевтически приемлемую соль.

26. Перорально распадающаяся таблетка по п. 24, отличающаяся тем, что количество ионного полимера составляет по меньшей мере приблизительно 55 мас.% от указанной дисперсии.

27. Перорально распадающаяся таблетка по п. 24, отличающаяся тем, что количество ионного полимера составляет по меньшей мере приблизительно 65 мас.% от указанной дисперсии.