



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012102247/15, 24.06.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
24.06.2009 US 61/220,027

(43) Дата публикации заявки: 27.07.2013 Бюл. № 21

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 24.01.2012(86) Заявка РСТ:
EP 2010/058960 (24.06.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2010/149727 (29.12.2010)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО
"Юридическая фирма Городиский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

МСД ОСС Б.В. (NL)

(72) Автор(ы):

ФАССЕН Веренфридус Андрианус (NL),
КЕМПЕРМАН Герардус Йоханнес (NL),
ВАН ЛАРХОВЕН Йоханнес Антониус
Хендрикус (NL)(54) **ИНЪЕКЦИОННЫЕ КОМПОЗИЦИИ, СОДЕРЖАЩИЕ АСЕНАПИН И СПОСОБ ЛЕЧЕНИЯ С ИХ ПРИМЕНЕНИЕМ**

(57) Формула изобретения

1. Фармацевтическая композиция, содержащая водную суспензию частиц кристаллической формы II гемипамоата асенапина, где гемипамоат асенапина находится в композиции в концентрации, превышающей, по меньшей мере, приблизительно 10 мг/мл.

2. Композиция по п. 1, где композиция включает фосфатный буфер и асенапин находится в концентрации, превышающей, по меньшей мере, приблизительно 100 мг/мл.

3. Композиция по п. 2, где частицы суспендированного гемипамоата асенапина имеют значение d_{50} приблизительно от 3,5 мкм до приблизительно 28 мкм при измерении посредством лазерной дифрактометрии.

4. Композиция по п. 3, дополнительно содержащая полиэтиленгликоль в качестве диспергирующего средства и где указанная композиция имеет рН, равный приблизительно 7,0.

5. Композиция, содержащая

(i) от более чем приблизительно 100 мг/мл до приблизительно 300 мг/мл несортированных частиц кристаллической формы II гемипамоата асенапина, где частицы имеют значение d_{50} приблизительно от 3,5 мкм до приблизительно 28 мкм согласно лазерной дифрактометрии;

(ii) воду;

(iii) до приблизительно 30 мг полиэтиленгликоля/мл присутствующей воды; и
(iv) буфер.

6. Фармацевтическая композиция, содержащая водную суспензию частиц кристаллической формы II гемипамоата асенапина, где

(i) указанные частицы имеют значение d_{50} приблизительно от 3,5 мкм до приблизительно 28 мкм согласно лазерной дифрактометрии; и

(ii) концентрация находящегося в композиции гемипамоата асенапина является, по меньшей мере, достаточной для того, чтобы в случае введения депо композиции в достаточном количестве пациенту посредством ВМ инъекции, она обеспечивала терапевтически эффективную концентрацию в плазме; определяемая в плазме концентрация не зависит от размера частиц.

7. Композиция по п. 5, где концентрация гемипамоата асенапина свыше, по меньшей мере, приблизительно 100 мг/мл.

8. Композиция по п. 5, где указанный буфер получают посредством объединения гидрофосфата натрия в количестве приблизительно от 1,0 мг/мл до приблизительно 1,2 мг/мл присутствующей воды, дигидрофосфата натрия в количестве приблизительно 0,5 мг/мл присутствующей воды, хлорида натрия в количестве приблизительно 7,6 мг/мл присутствующей воды и титрования смеси аликвотами гидроксида натрия и фосфорной кислоты до достижения смесью рН приблизительно равного 7,0.

9. Обеспечение лекарственного средства в болюсной дозируемой форме для лечения шизофрении или биполярного расстройства, обеспечиваемой посредством ВМ инъекции композиции по любому из пп. 1-8.

10. Депо дозируемая форма по п. 9, которая содержит объем, обеспечивающий терапевтически эффективную концентрацию асенапина в плазме на период 2 недели, 3 недели или 4 недели.

11. Соль гемипамоата асенапина, имеющая порошковую рентгенограмму, предложенную на Фигуре 3b.

12. Композиция, подходящая для депо введения, содержащая соль гемипамоата асенапина, имеющая порошковую рентгенограмму, предложенную на Фигуре 3b.

A
7
4
2
2
0
1
2
1
0
2
R
U

R
U
2
0
1
2
1
0
2
2
4
7
A