



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012153207/15, 10.12.2012

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
13.04.2006 **GB 0607534.5**(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,
из которой данная заявка выделена: **2008144700**
12.11.2008(43) Дата публикации заявки: **20.06.2014** Бюл. № 17

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

ЮНИВЕРСИТИ КОЛЛЕДЖ ЛОНДОН
(GB)

(72) Автор(ы):

БАСИТ Абдул Васех (GB),
ИБЕКВЕ Валентине Чиди (GB)**(54) ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА ДЛЯ ДОСТАВКИ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА В ТОЛСТУЮ КИШКУ****(57) Формула изобретения**

1. Лекарственная форма с отсроченным высвобождением лекарственного средства, включающая частицу с ядром и покрытием ядра, где ядро включает лекарственное средство, а покрытие включает смесь первого вещества, которое чувствительно к воздействию бактериями толстой кишки, и второго вещества, которое имеет порог pH при приблизительно pH 5 или выше, где первое вещество включает полисахарид, выбранный из группы, состоящей из крахмала, амилозы, амилопектина, хитозана, хондроитинсульфата, циклодекстрина, декстрана, пуллулана, каррагенана, склероглюкана, хитина, курдулана и левана.

2. Лекарственная форма по п.1, где полисахарид представляет собой крахмал.

3. Лекарственная форма по п.1 или 2, где полисахарид представляет собой крахмал, включающий по меньшей мере приблизительно 0,1% амилозы.

4. Лекарственная форма по п.3, где полисахарид представляет собой крахмал, включающий по меньшей мере 10%, предпочтительно по меньшей мере 15% амилозы.

5. Лекарственная форма по п.1 или 2, где полисахарид представляет собой крахмал, включающий до 100% амилопектина.

6. Лекарственная форма по п.1, где второе вещество представляет собой пленкообразующее полимерное вещество.

7. Лекарственная форма по п.6, где второе вещество представляет собой акрилатный полимер.

8. Лекарственная форма по п.1, где второе вещество представляет собой анионный сополимер (мет)акриловой кислоты и C₁₋₄ алкильного эфира (мет)акриловой кислоты.

9. Лекарственная форма по п.8, где второе вещество представляет собой анионный

сополимер метакриловой кислоты и метилового эфира метакриловой кислоты.

10. Лекарственная форма по п.9, где отношение метакриловой кислоты к метиловому эфиру метакриловой кислоты составляет приблизительно 1:2.

11. Лекарственная форма по п.1, где второе вещество представляет собой Eudragit® S.

12. Лекарственная форма по п.8, где второе вещество представляет собой сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата.

13. Лекарственная форма по п.1, где второе вещество представляет собой целлюлозный полимер или полимер на основе поливинила.

14. Лекарственная форма по п.13, где целлюлозный полимер представляет собой ацетатфталатцеллюлозы ("CAP"), ацетаттримеллитатцеллюлозы ("CAT") или ацетатсукцинатгидроксипропилметилцеллюлозы.

15. Лекарственная форма по п.13, где полимер на основе поливинила представляет собой поливинилацетатфталат ("PVAP").

16. Лекарственная форма по п.1, где соотношение первого вещества ко второму веществу составляет до приблизительно 35:65.

17. Лекарственная форма по п.16, где соотношение первого вещества ко второму веществу составляет от 15:85 до 35:65.

18. Лекарственная форма по п.1, где минимальный диаметр частицы составляет по меньшей мере приблизительно 5×10^{-4} м.

19. Лекарственная форма по п.1, где толщина покрытия, рассчитанная как теоретический привес ("TWG") покрытой лекарственной формы, составляет от 5 до 10%.

20. Лекарственная форма по п.1, где толщина покрытия, рассчитанная как теоретический привес ("TWG") покрытой лекарственной формы, составляет от 15 до 35%.

21. Лекарственная форма по п.1, где толщина покрытия составляет от приблизительно 10 мкм до приблизительно 150 мкм.

22. Лекарственная форма по п.1, где лекарственное средство включает по меньшей мере одну кислотную группу.

23. Лекарственная форма по п.1, где лекарственное средство представляет собой противовоспалительное средство.

24. Лекарственная форма по п.22 или 23, где лекарственное средство представляет собой 5-аминосалициловую кислоту.

25. Лекарственная форма по п.1, где лекарственное средство представляет собой стероид.

26. Лекарственная форма по п.25, где лекарственное средство выбрано из преднизолона, будезонида, флутиказона и их производных.

27. Лекарственная форма по п.1, где лекарственное средство представляет собой противоопухолевое средство.

28. Лекарственная форма по п.1 для применения в способе лечения терапией тела человека или животного.

29. Применение лекарственной формы по п.23 в производстве лекарственного препарата для лечения воспалительного заболевания кишки.

30. Применение лекарственной формы по п.27 в производстве лекарственного препарата для лечения карциномы.

31. Применение лекарственной формы по п.24 в производстве лекарственного препарата для профилактики карциномы.

32. Способ лечения IBD, включающий введение пациенту терапевтически эффективного количества лекарственной формы по п.23.

33. Способ лечения карциномы, включающий введение пациенту терапевтически эффективного количества лекарственной формы по п.27.

34. Способ предотвращения карциномы, включающий введение пациенту терапевтически эффективного количества лекарственной формы по п.24.

35. Способ получения лекарственной формы с отсроченным высвобождением по п.1, где способ включает:

формирование ядра, включающего лекарственное средство, и покрытие ядра полимерной покрывающей композиции, включающей смесь первого вещества, которое чувствительно к воздействию бактерий толстой кишки, и второго вещества, которое имеет порог рН при приблизительно рН 5 или выше,

где первое вещество включает полисахарид, выбранный из группы, состоящей из крахмала, амилозы, амилопектина, хитозана, хондроитинсульфата, циклодекстрина, декстрана, пуллулана, каррагенана, склероглюкана, хитина, курдулана и левана.

36. Способ по п.35, где ядро покрыто распылением указанной полимерной покрывающей композиции.

37. Способ по п.35 или 36, включающий:

приготовление водной дисперсии указанного первого вещества, приготовление спиртового или водного раствора указанного второго вещества и добавление по меньшей мере части указанной водной дисперсии указанного первого вещества к по меньшей мере части спиртового или водного раствора указанного второго вещества для получения указанной полимерной покрывающей композиции.

38. Способ направленной доставки лекарственного средства в толстую кишку, включающий введение пациенту лекарственной формы по п.1.