



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ(21)(22) Заявка: **2012101214/15, 15.06.2010**

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
16.06.2009 US 61/187,442(43) Дата публикации заявки: **27.07.2013** Бюл. № 21(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: **16.01.2012**(86) Заявка РСТ:
US 2010/038660 (15.06.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2010/147978 (23.12.2010)

Адрес для переписки:

**119019, Москва, Гоголевский б-р, 11, этаж 3,
"Гоулингз Интернэшнл Инк.", В.М. Угрюмову**

(71) Заявитель(и):

**ПФАЙЗЕР ИНК. (US),
БРИСТОЛ-МАЙЕРС СКВИББ
КОМПАНИ (US)**

(72) Автор(ы):

НОЗ Ричард Г. (US)**(54) ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ФОРМЫ АПИКСАБАНА****(57) Формула изобретения**

1. Лекарственная форма, содержащая
апиксабан с улучшенной растворимостью, где указанная лекарственная форма
обеспечивает контролируемое высвобождение апиксабана.

2. Лекарственная форма по п.1, где указанная лекарственная форма представляет
собой лекарственную форму с контролируемым высвобождением, которая
высвобождает *in vivo* или *in vitro* 70 мас.% апиксабана на протяжении 2 ч или более
после введения указанной лекарственной формы в водные условия применения.

3. Лекарственная форма по п.1, где лекарственная форма с контролируемым
высвобождением представляет собой лекарственную форму с осмотически
контролируемым высвобождением.

4. Лекарственная форма по п.3, где лекарственная форма с контролируемым
высвобождением представляет собой двухслойную лекарственную форму с осмотически
контролируемым высвобождением.

5. Лекарственная форма по п.1, где после введения в условия применения *in vivo*,
указанная лекарственная форма обеспечивает плазменную концентрацию апиксабана
примерно 70 нг/мл или более в течение периода времени примерно 12 ч или более.

6. Лекарственная форма по п.1, где указанная форма с улучшенной растворимостью
выбрана из группы, состоящей из твердой аморфной дисперсии, липидного носителя,
содержащего апиксабан, твердого адсорбата, содержащего апиксабан, адсорбированный

на субстрате, наночастиц, адсорбатов аликсабана в поперечно сшитом полимере, наносuspension, переохлажденной формы, лекарственной формы аликсабан/циклодекстрин, формы мягкого геля, самоэмульгирующейся формы, трехфазной формы аликсабана, кристаллической высокорастворимой формы, высокоэнергетической кристаллической формы, гидрата или сольвата кристаллической формы, аморфной формы, смеси аликсабана и солюбилизующего агента, и раствора указанного аликсабана, растворенного в жидкости.

7. Лекарственная форма по п.1, где указанная форма с улучшенной растворимостью представляет собой твердую аморфную дисперсию, содержащую аликсабан и полимер.

8. Лекарственная форма по п.7, где указанная твердая аморфная дисперсия представляет собой дисперсию, высушенную распылением.

9. Лекарственная форма по п.4, где указанная лекарственная форма с осмотически контролируемым высвобождением содержит твердую аморфную дисперсию, содержащую аликсабан и полимер.

10. Лекарственная форма по п.9, где указанная твердая аморфная дисперсия, содержащая аликсабан и полимер, представляет собой дисперсию, высушенную распылением.

11. Лекарственная форма по п.10, где указанная лекарственная форма с осмотически контролируемым высвобождением содержит двухслойную таблетку, содержащую отверстие.

12. Лекарственная форма по п.11, где после введения в *in vivo* условия применения указанная лекарственная форма обеспечивает концентрацию аликсабана в плазме примерно 70 нг/мл или более в течение периода времени примерно 12 ч или более.

13. Лекарственная форма по п.1, где лекарственная форма с контролируемым высвобождением представляет собой лекарственную форму с контролируемым высвобождением из матрицы.

14. Лекарственная форма по п.13, где указанная лекарственная форма с контролируемым высвобождением из матрицы содержит твердую аморфную дисперсию, содержащую указанный аликсабан и полимер, и указанная твердая аморфная дисперсия представляет собой дисперсию, высушенную распылением.

15. Лекарственная форма по п.1, имеющая скорость растворения *in vitro*, где скорость растворения *in vitro* составляет примерно менее 10 мас.% аликсабана, высвобождающегося за один час, примерно от 20 мас.% аликсабана примерно до 40 мас.% аликсабана, высвобождающегося за четыре часа, примерно от 60 мас.% аликсабана примерно до 80 мас.% аликсабана, высвобождающегося примерно за восемь часов, и примерно более 70 мас.% аликсабана, высвобождающегося за десять часов.

16. Лекарственная форма по п.1, имеющая скорость растворения *in vitro*, где скорость растворения *in vitro* составляет примерно менее 20 мас.% аликсабана, высвобождающегося за один час, примерно от 20 мас.% аликсабана примерно до 40 мас.% аликсабана, высвобождающегося за два часа, примерно от 50 мас.% аликсабана примерно до 75 мас.% аликсабана, высвобождающегося примерно за четыре часа, и примерно более 70 мас.% аликсабана, высвобождающегося за шесть часов.

17. Лекарственная форма по п.1, имеющая среднюю скорость высвобождения, где средняя скорость высвобождения аликсабана составляет примерно от 7 мас.%/ч примерно до 10 мас.%/ч.

18. Лекарственная форма по п.1, имеющая среднюю скорость высвобождения, где средняя скорость высвобождения аликсабана составляет примерно от 11 мас.%/ч примерно до 18 мас.%/ч.

19. Способ лечения тромбоэмболических заболеваний, предусматривающий введение млекопитающему, нуждающемуся в таком лечении, лекарственной формы по любому

из пп.1-18.

20. Способ по п.19, где тромбоз эмболическим заболеванием является тромбоз эмболия вен, тромбоз глубоких вен, острый коронарный синдром или артериальный тромбоз.

RU 2012101214 A

RU 2012101214 A