(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
9. Januar 2014 (09.01.2014)

WIPO | PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2014/005934 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:
A61K 9/00 (2006.01) *A61K 31/00* (2006.01)
A61K 9/24 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2013/063590

(22) Internationales Anmeldedatum:
28. Juni 2013 (28.06.2013)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
12174797.6 3. Juli 2012 (03.07.2012) EP

(71) Anmelder: **BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE]; Müllerstr. 178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder: **BENKE, Klaus**; Malteserweg 16, 51465 Bergisch Gladbach (DE). **NEUMANN, Heike**; Fehlerstr. 8, 12161 Berlin (DE). **MÜCK, Wolfgang**; Obere Bergerheide 16, 42113 Wuppertal (DE).

(74) Anwalt: **BIP PATENTS**; c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Creative Campus Monheim, Alfred-Nobel-Str. 10, 40789 Monheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)*

Veröffentlicht:

— *mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)*

— *vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eingehen (Regel 48 Absatz 2 Buchstabe h)*

(54) **Title**: PHARMACEUTICAL ADMINISTRATION FORMS COMPRISING 5-CHLORO-N-({(5S)-2-OXO-3-[4-(3-OXO-4-MORPHOLINYL)PHENYL]-1,3-OXAZOLIDIN-5-YL}METHYL)-2-THIOPHENECARBOXAMIDE

(54) **Bezeichnung** : PHARMAZEUTISCHE DARREICHUNGSFORMEN ENTHALTEND 5-CHLOR-N-({(5S)-2-OXO-3-[4-(3-OXO-4-MORPHOLINYL)-PHENYL]-1,3-OXAZOLIDIN-5-YL}-METHYL)-2-THIOPHEN-CARBOXAMID

(57) **Abstract**: the present invention relates to solid, orally administrable pharmaceutical administration forms comprising 5-chloro-N-({(5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morpholinyl)-phenyl]-1,3-oxazol- idin-5-yl}methyl)-2-thiophenecarboxamide (rivaroxaban, active ingredient (I)), characterized in that a portion of the active ingredient (I) is released in a rapid manner and a portion in a controlled (modified, retarded, delayed) manner, and to processes for production thereof, use thereof as medicaments, and use thereof for prophylaxis, secondary prophylaxis or treatment of disorders.

(57) **Zusammenfassung**: Die vorliegende Erfindung betrifft feste, oral applizierbare pharmazeutische Darreichungsformen enthaltend 5-Chlor-N-({(5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morpholinyl)-phenyl]-1,3-oxazolidin-5-yl}-methyl)-2-thiophen-carboxamid (Rivaroxaban, Wirkstoff (I)), dadurch gekennzeichnet, dass eine Teilmenge des Wirkstoffs (I) schnell und eine Teilmenge kontrolliert (modifiziert, retardiert, verzögert) freigegeben wird, sowie Verfahren zu ihrer Herstellung, ihrer Anwendung als Arzneimittel, sowie ihrer Verwendung zur Prophylaxe, Sekundärprophylaxe oder Behandlung von Erkrankungen.

WO 2014/005934 A1