

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

(21)(22) Заявка: 2015137145, 13.02.2014

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
28.02.2013 US 61/770,988

(43) Дата публикации заявки: 03.04.2017 Бюл. № 10

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 28.09.2015(86) Заявка РСТ:
IB 2014/058978 (13.02.2014)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2014/132163 (04.09.2014)Адрес для переписки:
107061, Москва, Преображенская площадь, д. 6,
ООО "Вахнина и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

ПФАЙЗЕР ИНК. (US)

(72) Автор(ы):

**АГИЗИМ Гери Роберт (US),
ФРИДЛАЙН Роберт Алан (US),
ПЕЙТЕЛЬ Шиванджи Виякумар (US),
СЕРТЦЕН Цезарь Айван (US),
ШЕППЕРСОН Ванесса Роуз (US)**(54) **НОВЫЕ ЖИДКИЕ КОМПОЗИЦИИ С ПОВЫШЕННОЙ СТАБИЛЬНОСТЬЮ**

(57) Формула изобретения

1. Жидкая оральная фармацевтическая композиция, содержащая:
 - i.) от приблизительно 0,1% до приблизительно 20% вес/об. поливинилпирролидона;
 - ii.) от приблизительно 5% до приблизительно 70% вес/об. полиэтиленгликоля;
 - iii.) от приблизительно 1% до приблизительно 30% вес/об. пропиленгликоля;
 - iv.) от приблизительно 1% до 10% вес/об. гвайфензина; и
 - v.) от приблизительно 0,01% до приблизительно 1,0% вес/об. фенилэфрина.
2. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что дополнительно содержит противокашлевый агент.
3. Композиция по п. 2, отличающаяся тем, что противокашлевым агентом является декстрометорфан.
4. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что композиция представляет собой раствор или суспензию.
5. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что содержит приблизительно 0,5% вес/об. поливинилпирролидона.
6. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что содержит приблизительно 10% вес/об. полиэтиленгликоля.
7. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что содержит приблизительно 10% вес/об. пропиленгликоля.
8. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что содержит приблизительно 4% вес/об.

гвайфензина.

9. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что содержит приблизительно 0,10% вес/об. фенилэфрина.

10. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что дополнительно содержит ароматизатор.

11. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что соотношение поливинилпирролидона и гвайфензина в композиции составляет 1:8 при наличии фенилэфрина.

12. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что композиция визуальна свободна от осадка гвайфензина в течение, по меньшей мере, 62 дней при 4°C.

13. Жидкая композиция по п. 1, содержащая приблизительно 4% вес/об. гвайфензина и приблизительно 0,10% вес/об. фенилэфрина, отличающаяся тем, что композиция визуальна свободна от осадка гвайфензина в течение 14 дней при -20°C.

14. Жидкая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что композиция содержит 4% вес/об. гвайфензина и приблизительно 0,10% вес/об. фенилэфрина, приблизительно меньше чем 2% всех продуктов распада фенилэфрина, как весовой процент по весу фенилэфрина, и приблизительно меньше чем 2% потери фенилэфрина от начального общего содержания фенилэфрина, измеренного в течение 3 месяцев при хранении при 40°C и относительной влажности 75%.

15. Жидкая оральная фармацевтическая композиция, содержащая:

vii.) приблизительно 0,2% вес/об. декстрометорфана;

viii.) приблизительно 4% вес/об. гвайфензина;

ix.) приблизительно 0,1% вес/об. фенилэфрина;

x.) приблизительно 10% вес/об. пропиленгликоля;

xi.) приблизительно 10% вес/об. полиэтиленгликоля; и

xii.) приблизительно 0,5% вес/об. поливинилпирролидона.

16. Жидкая композиция по п. 15, отличающаяся тем, что композиция содержит приблизительно 4% вес/об. гвайфензина и приблизительно 0,10% вес/об. фенилэфрина, и композиция визуальна свободна от осадка гвайфензина в течение 14 дней при -20°C.

17. Композиция по п. 15, отличающаяся тем, что композиция визуальна свободна от осадка гвайфензина в течение 62 дней при 4°C.

18. Жидкая оральная фармацевтическая композиция по п. 15, отличающаяся тем, что композиция содержит приблизительно меньше чем 2% всех продуктов распада фенилэфрина, как весовой процент по весу фенилэфрина, и приблизительно меньше чем 2% потери фенилэфрина от первоначального общего содержания фенилэфрина, измеренное в течение 3 месяцев при хранении при 40°C и относительной влажности 75%.

19. Способ приготовления жидкой оральной композиции, включающий этапы:

a.) смешивания до полного растворения от приблизительно 0,1% до приблизительно 20% вес/об. поливинилпирролидона в водной фазе;

b.) добавления и смешивания от приблизительно 1% до приблизительно 20% вес/об., по меньшей мере, одного фармацевтического агента;

c.) последовательного добавления и смешивания:

i.) воды;

ii.) от приблизительно 1% до приблизительно 30% вес/об. пропиленгликоля;

iii.) от приблизительно 5% до приблизительно 70% вес/об. полиэтиленгликоля; и

d.) последовательного добавления и смешивания одного или нескольких дополнительных ингредиентов.

20. Способ по п. 17, отличающийся тем, что композиция содержит приблизительно меньше чем 2% всех продуктов распада сренилэфрина, как весовой процент по весу фенилэфрина, и приблизительно меньше чем 2% потери фенилэфрина от

первоначального общего содержания фенилэфрина, измеренное в течение 3 месяцев при хранении при 40°C и относительной влажности 75%.

21. Способ по п. 17, отличающийся тем, что композиция визуально свободна от осадка гвайфензина в течение 62 дней при 4°C.

22. Способ приготовления композиции со сниженной преципитацией первого фармацевтического агента в комбинации с, по меньшей мере, одним или несколькими другими фармацевтическими агентами в водной фазе, отличающийся тем, что композиция содержит приблизительно меньше чем 2% всех продуктов распада фенилэфрина, как весовой процент по весу фенилэфрина, и приблизительно меньше чем 2% потери фенилэфрина от первоначального общего содержания фенилэфрина, измеренное в течение 3 месяцев при хранении при 40°C и относительной влажности 75%, включающий этапы:

a.) смешивания до полного растворения от приблизительно 0,1% до приблизительно 20% вес/об. поливинилпирролидона в водной фазе;

b.) добавления и смешивания от приблизительно 1% до приблизительно 20% вес/об., по меньшей мере, одного фармацевтического агента;

c.) последовательного добавления и смешивания:

i.) воды;

ii.) от приблизительно 1% до приблизительно 10% вес/об. пропиленгликоля,

iii.) от приблизительно 10% до приблизительно 70% вес/об. полиэтиленгликоля; и

d.) последовательного добавления и смешивания одного или нескольких дополнительных ингредиентов.

RU 2015137145 A

RU 2015137145 A