



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ**

(21)(22) Заявка: 2012143705, 01.04.2011

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
01.04.2011

Дата регистрации:
01.03.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
01.04.2010 US 61/320,202

(43) Дата публикации заявки: 10.05.2014 Бюл. № 13

(45) Опубликовано: 01.03.2017 Бюл. № 7

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 01.11.2012

(86) Заявка РСТ:
US 2011/031020 (01.04.2011)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/123836 (06.10.2011)

Адрес для переписки:
190000, Санкт-Петербург, ВОХ-1125,
ПАТЕНТИКА

(72) Автор(ы):

ПАБОРДЖИ Мехди (US),
ТУОХИ Ш Роберт В. (US),
ФРИД Питер Р.П. (US),
ФЛЮГЕЛЬ Роджер С. (US)

(73) Патентообладатель(и):

ТЕРАВИДА, ИНК. (US)

(56) Список документов, цитированных в отчете
о поиске: US 2007/0077300 A1, 05.04.2007. RU
2382637 C2, 27.02.2010. US 2004/0185111 A1,
23.09.2004. US 2007/0224269 A1, 27.09.2007.
US 2007/0053995 A1, 08.03.2007. US 2005/
0287211 A1, 29.12.2005.

(54) **ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ**

(57) Формула изобретения

1. Фармацевтическая композиция для увеличения слюноотделения, содержащая множество гранул, каждая из которых содержит:

ядро, содержащее один или более из целлюлозного полимера, диоксида кремния и сахара, выбранного из группы, состоящей из глюкозы, сахарозы, лактозы, маннитола, ксилитола и сорбитола;

первый слой, содержащий пилокарпин или его фармацевтически приемлемую соль;

и

второй слой, содержащий гидроксипропилцеллюлозу и этилцеллюлозу в массовом соотношении 1:1, причем масса второго слоя составляет от 75% до 250% массы гранулы до нанесения второго слоя.

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что целлюлозный полимер представляет собой полимер микрокристаллической целлюлозы.

3. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что ядро составляет

от примерно 10% до примерно 50% от общей массы готовой гранулы.

4. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что первый слой составляет от примерно 1% до примерно 50% от общей массы гранулы.

5. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что гранула дополнительно содержит вещество для снижения клейкости или вещество, способствующее скольжению, выбранные из группы, состоящей из талька, глицерилмоностеарата, стеарата кальция и стеарата магния.

6. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что гранула дополнительно содержит пластификатор, выбранный из группы, состоящей из пластификатора на основе фталата, выбранного из группы, состоящей из бис(2-этилгексил)фталата (ДЭГФ), диизононилфталата (ДИНФ), бис(н-бутил)фталата (ДнБФ, ДБФ), бутилбензилфталата (ББзФ), диизодецилфталата (ДИДФ), ди-н-октилфталата (ДОФ или ДнОФ), диизооктилфталата (ДИОФ), диэтилфталата (ДЭФ), диизобутилфталата (ДИБФ) и ди-н-гексил фталата, тримеллитата, пластификатора на основе адипината, выбранного из группы, состоящей из бис(2-этилгексил)адипата (ДЭГА), диметиладипата (ДМА), монометиладипата (ММА) и диоктиладипата (ДОА), дибутилсебагината (ДБС), органофосфата, малеата, сульфонида, гликолей или полиэфира, ацетилированного моноглицерида и алкилцитрата.

7. Фармацевтическая композиция по п. 1, отличающаяся тем, что первый слой дополнительно содержит липидный наполнитель, выбранный из группы, состоящей из глицерилбегената, глицериновых эфиров жирных кислот, глицерилдигбегената, бегеноил-макроголглицеридов, глицерилдистеарата, глицеролдистеарата, глицерилпальмитостеарата, лауроил-макроголглицеридов, стеароил-макроголглицеридов, продуктов абитека, глицерилмоноолеата, моно- и диглицеридов со средней длиной цепи, глицерилмонокаприлата, глицерилтрикаприлата/капрата/стеарата, гидрогенизированного растительного масла, гидрогенизированного хлопкового масла, гидрогенизированного соевого масла, гидрогенизированного соевого масла и касторового воска, полиоксиэтилена 8 каприловых/каприновых глицеридов, полиоксиэтилена 6 каприловых/каприновых глицеридов, полиоксиэтилена 32 лауриновых глицеридов, полиоксиэтилена 6 эфиров пропиленгликоля, полиоксиэтилена 7 глицеридов кокосового масла, полиоксиэтилена 30 глицеридов кокосового масла, полиоксиэтилена 80 глицеридов кокосового масла, полиоксипропилена 15 стеарилового эфира, полиоксиэтилена 26 глицерилового эфира, полиоксиэтилена 35 соевых глицеридов, полиоксиэтилена 20 сорбитола, полиоксипропилена 3 миристилового эфира, полиоксипропилена 10 цетостеарилового эфира, пальмового кернеламида диэтаноламида, триглицерол моноолеата, продуктов сазола, гидрогенизированных кокоглицеридов, цетилпальмитата, тримиристина, трипальмитина, тристеарина, гидрогенизированного пальмового масла, глицерилмоностеарата, глицерилстеарата, цетеарилового спирта, цетилового спирта, капринового триглицерида, ацетилированных глицеридов, глицерилкокоата и полиэтиленгликоля.

8. Фармацевтическая композиция по п. 1, дополнительно содержащая мускариновый антагонист или его фармацевтически приемлемую соль.

9. Фармацевтическая композиция по п. 8, отличающаяся тем, что мускариновый антагонист представляет собой оксибутинин.

10. Фармацевтическая композиция по п. 8, содержащая:

а) пилокарпин или его фармацевтически приемлемую соль в дозировке в диапазоне 0,5-50 мг; и

б) оксибутинин или его фармацевтически приемлемую соль в дозировке в диапазоне 0,1-100 мг.