



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21) Patenttihakemus-Patentansökan 883337
(51) Kv.lk.⁴/Int.cl.⁴ A 61 K 31/65
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 13.07.88
(23) Alkupäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 17.01.89
(86) Kv. hakemus-Int.ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 16.07.87 US 074189

(71) Hakija/Sökande: *Bristol-Myers Company*, 345 Park Avenue, New York, New York, USA

(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Kaplan, Murray Arthur 2. Bogardus, Joseph Ballard 3. Perrone, Robert Kevin

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Doksorubisiinihydrokloridin ei-vesiliuoksia. Icke-vattenlösningar av doxorubicinhydroklorin.

(57) Tiivistelmä

Keksintö koskee menetelmää doksorubisiini-HCl:n stabiilien, konsentroitujen ei-vesiliuosten valmistamiseksi, jotka sisältävät noin 5-10 mg/ml doksorubisiini-HCl:a, noin 0,1-2 mg/ml antioksidanttia, joka on natriumformaldehydibisulfiitti, tert-butyylhydrokinoni tai α -tokoferoli (vitamiini E), sitruunahappoa määrän, joka tarvitaan pH:n säätämiseksi alueelle 3-5, liuotinväliaineessa, jona on propyleeniglykoli, 1,2-dihydroksibutaani tai 1,3-dihydroksipropaani tai tällaisen ei-vesiliuottimen ja veden seos, jossa on enintään 10 tilavuus-% vettä. Liusten hyväksyttävä varastointiaika on huoneen lämpötilassa pitempi kuin 18 kuukautta ja ne voidaan laimentaa vedellä tai muilla ruoansulatuskanavan ulkopuoliseen käyttöön soveltuvilla vesivehikkeleillä ruoansulatuskanavan ulkopuolisesti annettaviksi.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av stabila, koncentrerade, icke-vattenhaltiga lösningar av doxorubicin-HCl, vilka innehåller doxorubicin-HCl, citronsyra och ett antioxidationsmedel, vilket valts bland natriumformaldehyd-bisulfit, tert.-butylhydrokinon och α -tokoferol (vitamin E) i ett lösningsmedel som består av propylenglykol, 1,2-dihydroxibutan eller 1,3-dihydroxipropan, eller blandningar av dylika vattenfria lösningsmedel med vatten. Lösningarna har en godtagbar lagringstid som överstiger 18 månader vid rumstemperatur och de kan utspädas med vatten eller andra vattenhaltiga parenterala bärare för parenteral administration.