



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2004132205/15, 28.03.2003

(30) Приоритет: 03.04.2002 EP 02007568.5

(43) Дата публикации заявки: 10.09.2005 Бюл. № 25

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 03.11.2004(86) Заявка РСТ:
EP 03/03263 (28.03.2003)(87) Публикация РСТ:
WO 03/082285 (09.10.2003)Адрес для переписки:
101000, Москва, М.Златоустинский пер., д.10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", И.А.Веселицкой

(71) Заявитель(и):

БЕРИНГЕР ИНГЕЛЬХАЙМ ИНТЕРНАЦИОНАЛЬ
ГМБХ (DE)

(72) Автор(ы):

Норитака СЕКО (JP)

(74) Патентный поверенный:

Веселицкая Ирина Александровна

(54) КОМБИНАЦИИ ЭПИНАСТИНА, БЕЛЛАДОННЫ И ПСЕВДОЭФЕДРИНА В КАЧЕСТВЕ НОВЫХ
ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИХ СОСТАВОВ

Формула изобретения

1. Фармацевтические композиции для перорального применения, содержащие в качестве активных веществ комбинации а) эпинастина или его фармацевтически приемлемой соли в количестве, обеспечивающем антигистаминное действие, б) алкалоидов белладонны или их фармацевтически приемлемых солей в количестве, обеспечивающем антихолинэргическое действие, и в) псевдоэфедрина или его фармацевтически приемлемых солей в количестве, обеспечивающем противоотечное действие, необязательно в комбинации с метилэфедрином или его фармацевтически приемлемой солью, а также включающие фармацевтически приемлемые носители или эксципиенты.

2. Фармацевтическая композиция для перорального применения по п.1, отличающаяся тем, что алкалоиды белладонны представлены по крайней мере одним алкалоидом, выбранным из группы, включающей атропин, L-(-)-гиосциамин, L-(-)-гиосцин, N-оксиды гиосцина и/или гиосциамина, атропина, белладоннина и необязательно никотин, N-метилпирролин, N-метилпирролидин, пиридин, кускигрин.

3. Фармацевтическая композиция для перорального применения по пп.1 или 2, отличающаяся тем, что все активные ингредиенты переработаны для немедленного высвобождения.

4. Фармацевтическая композиция для перорального применения по п.1 или 2, отличающаяся тем, что эпинастин или его фармацевтически приемлемая соль переработаны для немедленного высвобождения и по крайней мере часть других активных ингредиентов, т.е. алкалоидов белладонны или их фармацевтически приемлемой соли,

псевдоэфедрина или его фармацевтически приемлемой соли, и необязательно метилэфедрина, переработаны для медленного высвобождения.

5. Фармацевтическая композиция для перорального применения по п.4, отличающаяся тем, что общее количество алкалоидов белладонны или их фармацевтически приемлемой соли, псевдоэфедрина или его фармацевтически приемлемой соли и необязательно метилэфедрина переработаны для медленного высвобождения.

6. Фармацевтическая композиция для перорального применения по п.1 или 2, отличающаяся тем, что в состав входит метилэфедрин или его фармацевтически приемлемая соль.

7. Фармацевтическая композиция для перорального применения по п.1 или 2, отличающаяся тем, что диапазон концентрации эпинастина или его фармацевтически приемлемой соли составляет от 2 до 20 мг в суточной дозы, диапазон концентрации алкалоидов белладонны или их фармацевтически приемлемой соли составляет от 0,05 до 4 мг суточной дозы и диапазон концентрации псевдоэфедрина вместе с метилэфедрином или соответствующих им фармацевтически приемлемых солей составляет от 5 до 240 мг в суточной дозы.

8. Фармацевтическая композиция для перорального применения по п.7, отличающаяся тем, что концентрации псевдоэфедрина и метилэфедрина равны.

9. Фармацевтическая композиция для перорального применения по п.1 или 2, отличающаяся тем, что она представлена в виде двухслойной таблетки.

10. Двухслойная таблетка по п.9, в которой первый слой А, обеспечивающий медленное высвобождение алкалоидов белладонны, псевдоэфедрина и необязательно метилэфедрина или соответствующих данным активным ингредиентам фармацевтических солей, содержит количества этих веществ по п.1, и второй слой Б, обеспечивающий быстрое высвобождение эпинастина, содержит эпинастин или его фармацевтически приемлемую соль в количестве, обеспечивающем антигистаминное действие.

11. Двухслойная таблетка по п.10, отличающаяся тем, что слой А, содержит 60 мг псевдоэфедрина гидрохлорида, 60 мг метилэфедрина гидрохлорида и 0,3 мг алкалоидов белладонны, и слой Б содержит 10 мг эпинастина гидрохлорида, или таблетка, в которой один из компонентов приводится в половинном количестве.

12. Двухслойная таблетка по п.10, отличающаяся тем, что дополнительно содержит покрытие В, состоящее из фармацевтически приемлемых эксципиентов.

13. Двухслойная таблетка по п.10, отличающаяся тем, что слой А содержит псевдоэфедрин или его фармацевтически приемлемую соль в количестве, обеспечивающем противоотечное действие, и метилэфедрин или его фармацевтически приемлемую соль и алкалоиды белладонны или их фармацевтически приемлемые соли в количестве, обеспечивающем антихолинэргическое действие, на матриксе способного к набуханию гидрофильного полимера.

14. Капсула с составом для парентерального применения по одному из пп.1-9.

15. Капсула по п.14, отличающаяся тем, что материал капсул содержит вещество, выбранное из группы, включающей хитозан, крахмал, муку злаков, олигосахариды, метакриловую кислоту-метилакрилат, метакриловую кислоту-этилакрилат, гидроксипропилметилцеллюлозоацетат, -сукцинат или -фталат, поливиниловый спирт, водорастворимые нетоксичные термопласты, гидроксипропилметилцеллюлозу, метилцеллюлозу, гидроксипропилцеллюлозу, гидроксипропилкрахмал, альгинат натрия, желатин, жесткий желатин и пуллулан.

16. Капсула по п.14, отличающаяся тем, что ингредиенты скомпонованы в капсулы медленного и быстрого высвобождения.

17. Капсула по п.16 в комбинации с пп.4 или 5.

18. Капсула по п.16, отличающаяся тем, что гранулы медленного высвобождения покрыты водорастворимыми полимерами, полимерами, растворяющимися в кишечнике, парафиновыми восками, высшими спиртами, высшими жирными кислотами и/или сложными эфирами высших жирных кислот.

19. Таблетка с составом для парентерального применения по одному из пп.1-9,

отличающаяся тем, что ингредиенты перерабатывают в гранулы, которые прессуют в таблетки.

20. Таблетка по п.19, отличающаяся тем, что ингредиенты перерабатывают в капсулы медленного и быстрого высвобождения.

21. Таблетка по п.20 в комбинации с пп.4 или 5.

22. Таблетка по п.20, отличающаяся тем, что гранулы медленного высвобождения покрыты водорастворимыми полимерами, полимерами, растворяющимися в кишечнике, парафиновыми восками, высшими спиртами, высшими жирными кислотами и/или сложными эфирами высших жирных кислот.

23. Применение фармацевтической композиции по одному из пп.1-9, двухслойной таблетки по любому из пп.10-13, капсулы по любому из пп.14-18 или таблетки по любому из пп.19-21 для лечения сезонного аллергического ринита, сезонного аллергического конъюнктивита, аллергического ринита, аллергического застоя в евстахиевых трубах и/или других заболеваний аллергического происхождения, заслуживающих применения антигистаминных и противоотечных средств, для лечения насморка и облегчения симптомов, связанных с кашлем, простудой и гриппом.

24. Применение по п.23 для лечения сезонного аллергического ринита и/или сезонного аллергического конъюнктивита.