



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ(21)(22) Заявка: **2015132902, 07.01.2013**

Приоритет(ы):

(22) Дата подачи заявки: **07.01.2013**(43) Дата публикации заявки: **09.02.2017** Бюл. № 04(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: **07.08.2015**(86) Заявка РСТ:
KR 2013/000107 (07.01.2013)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2014/106962 (10.07.2014)

Адрес для переписки:

**129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городиский и Партнеры"**

(71) Заявитель(и):

САМ-А ФАРМ. КО., ЛТД. (KR)

(72) Автор(ы):

**ЛИ Дзонг Хоон (KR),
ШИМ Санг Бо (KR),
КИМ Санг Вook (KR),
И Хонг Ги (KR)****(54) НОВЫЙ БЫСТРОРАСТВОРИМЫЙ СОСТАВ ГРАНУЛ С УЛУЧШЕННОЙ РАСТВОРИМОСТЬЮ****(57) Формула изобретения**

1. Быстрорастворимый состав гранул, который получают с помощью гранулирования активного ингредиента и по меньшей мере одного быстрорастворимого носителя, выбранного из группы, состоящей из сахаров и сахарных спиртов, где состав гранул быстро растворяется в ротовой полости после перорального введения.

2. Быстрорастворимый состав гранул по п. 1, где состав гранул растворяется в течение 20 секунд в ротовой полости.

3. Быстрорастворимый состав гранул по п. 1 или 2, в котором сахара или сахарные спирты выбраны из группы, состоящей из ксилита, маннита, изомальта, сорбита, мальтита, рафинированного сахара, лактозы, инозита, эритрита, кристаллической фруктозы, трегалозы, рибита, арабита, галактита, лактита, мальтотрита и их смесей.

4. Быстрорастворимый состав гранул по п. 3, в котором быстрорастворимый носитель и активный ингредиент находятся в количестве 40 масс.% ~ 99,995 масс.% и 0,005 масс.% ~ 60 масс.% общего состава, соответственно.

5. Быстрорастворимый состав гранул по п. 4, где состав представляет собой конечную лекарственную форму, которая не оставляет ощущения постороннего вещества и остаточного ощущения, даже если принимается без воды.

6. Лекарственный препарат, содержащий состав гранул по п. 5, содержащийся в единичной упаковке разовой дозы.

7. Быстрорастворимый состав гранул, который получают с помощью гранулирования активного ингредиента и по меньшей мере одного быстрорастворимого носителя, где

состав гранул растворяется в течение 20 секунд в ротовой полости при пероральном введении.

8. Быстрорастворимый состав гранул по п. 7, в котором состав гранул не оставляет ощущения постороннего вещества и остаточного ощущения, даже если принимается без воды.

9. Быстрорастворимый состав гранул по п. 8, в котором быстрорастворимый носитель соответствует следующим требованиям (1), (2) и (3):

(1) мгновенная растворимость, по меньшей мере, 30 мг/мл;

(2) растворимость через 5 минут, по меньшей мере, 50 мг/мл; и

(3) мгновенная растворимость представляет собой 90% или менее от максимальной растворимости.

10. Быстрорастворимый состав гранул по п. 9, в котором быстрорастворимый носитель представляет собой сахар или сахарный спирт.

11. Быстрорастворимый состав гранул по п. 10, в котором сахар или сахарный спирт имеет ниже -4 ккал/г теплоту растворения.

12. Быстрорастворимый состав гранул по п. 10, в котором сахар и сахарный спирт выбран из группы, состоящей из ксилита, маннита, изомальта, сорбита, мальтита, рафинированного сахара, лактозы, инозита, эритрита, кристаллической фруктозы, трегалозы, рибита, арабита, галактита, лактита, мальтотрита и их смесей.

13. Быстрорастворимый состав гранул по п. 12, в котором сахарный спирт представляет собой ксилит.

14. Быстрорастворимый состав гранул по п. 13, где состав гранул не оставляет ощущения постороннего вещества и остаточного ощущения, даже если принимается без воды.

15. Лекарственный препарат, содержащий состав гранул по п. 9, содержащийся в единичной упаковке разовой дозы.

16. Способ получения состава гранул, который быстро растворяется в ротовой полости после перорального введения, включающий:

(1) смешивание активного ингредиента по меньшей мере с одним быстрорастворимым носителем, выбранным из сахара и сахарного спирта;

(2) получение связывающего раствора с помощью растворения фармацевтически приемлемого связывающего вещества в растворителе очищенная вода;

(3) образование гранул с помощью распыления раствора стадии (2) на смесь стадии (1); и

(4) получение состава гранул с помощью смешивания полученного в результате продукта стадии (3) по меньшей мере с одной фармацевтически приемлемой добавкой.

17. Способ получения состава гранул, который быстро растворяется в ротовой полости после перорального введения, включающий:

(1) получение связывающего раствора с помощью растворения или суспендирования активного ингредиента и по меньшей мере фармацевтически приемлемого связывающего вещества в растворителе;

(2) образование гранул с помощью распыления раствора стадии (1) на быстрорастворимый носитель, выбранный из сахара и сахарного спирта; и

(3) получение состава гранул с помощью смешивания полученного в результате продукта стадии (2) по меньшей мере с одной фармацевтически приемлемой добавкой.

18. Способ получения состава гранул по п. 16 или 17, в котором быстрорастворимый носитель соответствует следующим требованиям (1), (2) и (3):

(1) мгновенная растворимость, по меньшей мере, 30 мг/мл;

(2) растворимость через 5 минут, по меньшей мере, 50 мг/мл; и

(3) мгновенная растворимость представляет собой 90% или менее от максимальной растворимости.

19. Способ получения состава гранул по п. 18, в котором быстрорастворимый носитель выбран из группы, состоящей из ксилита, маннита, изомальта, сорбита, мальтита, рафинированного сахара, лактозы, инозита, эритрита, кристаллической фруктозы, трегалозы, рибита, арабита, галактита, лактита, мальтотрита и их смесей.

20. Способ получения состава гранул по п. 19, в котором быстрорастворимый носитель имеет ниже -4 ккал/г теплоту растворения.

21. Способ получения состава гранул по п. 20, в котором быстрорастворимый носитель представляет собой ксилит.

22. Гранулы для применения при производстве лекарственного средства, в котором гранулы получают с помощью гранулирования с использованием сахара или сахарного спирта, который

соответствует следующим требованиям (1), (2) и (3):

(1) мгновенная растворимость, по меньшей мере, 30 мг/мл;

(2) растворимость через 5 минут, по меньшей мере, 50 мг/мл; и

(3) мгновенная растворимость представляет собой 90% или менее от максимальной растворимости.

RU 2015132902 A

RU 2015132902 A