



(51) МПК
A61K 31/415 (2006.01)
A61K 9/22 (2006.01)
A61K 47/38 (2006.01)

**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2017123771, 06.07.2017

Приоритет(ы):

(22) Дата подачи заявки: 06.07.2017

(43) Дата публикации заявки: 10.01.2019 Бюл. № 01

Адрес для переписки:

125315, Москва, ул. Балтийская, 8, ФГБНУ
 "Научно-исследовательский институт
 фармакологии имени В.В. Закусова"

(71) Заявитель(и):

Федеральное государственное бюджетное
 научное учреждение
 "Научно-исследовательский институт
 фармакологии имени В.В. Закусова" (RU)

(72) Автор(ы):

Середенин Сергей Борисович (RU),
 Яркова Милада Альнордовна (RU),
 Алексеев Константин Викторович (RU),
 Блынская Евгения Викторовна (RU),
 Жердев Владимир Павлович (RU),
 Дурнев Андрей Дмитриевич (RU),
 Незнамов Григорий Георгиевич (RU)

(54) Фармацевтическая композиция пролонгированного действия на основе 5-этоксигидро-2-[2-(морфолино)-этилтио] бензимидазола дигидрохлорида и/или основания (Афобазола)

(57) Формула изобретения

1. Фармацевтическая композиция, содержащая 5-этоксигидро-2-[2-(морфолино)-этилтио] бензимидазола дигидрохлорид и/или основание (Афобазол) в терапевтически эффективном количестве, с замедленным высвобождением действующего вещества, включающая кроме него комбинацию модификаторов высвобождения, состоящую из по меньшей мере одного гидрофильного модификатора высвобождения и по меньшей мере одного замедлителя высвобождения при определенном их количественном соотношении, и другие фармацевтически приемлемые вспомогательные вещества - смазывающие/скользящие, наполнитель, связывающее и биоразлагаемую пленочную оболочку при следующем соотношении компонентов, мас. %:

5-этоксигидро-2-[2-(морфолино)-этилтио] бензимидазола дигидрохлорид	
и/или основание	5,00-30,00
Замедлитель высвобождения	50,50-70,00
Гидрофильный модификатор высвобождения	10,00-30,00
Наполнитель	0,00-33,00
Связывающее	0,00-6,00
Смазывающее/скользящее	0,25-5,00
Пленочная оболочка	0,00-3,00

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, содержащая в качестве замедлителя высвобождения: повидон и/или поливинилацетат (предпочтительны поливинилацетат и его сополимеры, например, Kollicoat VAS или Kollidon SR), производные акриловой кислоты (редкосшитые акриловые полимеры, метакриловая кислота, композиционный полимерный носитель (КПН)). Замедлитель высвобождения, например, присутствует

в количестве от приблизительно 50,5 мас. % до приблизительно 70 мас. % в расчете на массу композиции;

3. Фармацевтическая композиция по п. 1, которая в качестве гидрофильного модификатора высвобождения может содержать производные целлюлозы (метилцеллюлоза, этилцеллюлоза, гидроксипропилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза, гидроксиэтилцеллюлоза), кальция фосфат, кальция дигидрофосфат, кальция гидрофосфат дигидрат, кальция сульфат дигидрат, кальция карбонат основной, прежелатинизированный крахмал, эфиры целлюлозы, микрокристаллическую целлюлозу. Микрокристаллическая целлюлоза и смеси, содержащие ее и один или несколько дополнительных компонентов, например, предварительно прежелатинизированный крахмал - особенно предпочтительны. Модификаторы высвобождения, например, присутствуют в количестве от приблизительно 10 мас. % до приблизительно 30 мас. % в расчете на массу композиции;

4. Фармацевтическая композиция по п. 1, которая в качестве скользящих/смазывающих может содержать стеариновую кислоту и/или ее соли, аэросил, тальк, гидролизованное растительное масло, воск из карнауба, натрия лаурилсульфат; в качестве наполнителя может содержать производные целлюлозы, полисахариды, желатин, а также соли магния и кальция, коллоидный диоксид кремния в качестве целевых примесей к основному наполнителю; в качестве связывающих может содержать крахмальный клейстер, сахарный сироп, целлюлозу, растворы: карбоксиметилцеллюлозы (КМЦ), оксиэтилцеллюлозы (ОЭЦ), оксипропилметилцеллюлозы (ОПМЦ), натриевой соли карбоксиметилцеллюлозы; поливинилового спирта (ПВС), альгиновой кислоты, натрия альгината, желатина, метилцеллюлозы, гидроксипропилметилцеллюлозы, крахмала; растворители: вода очищенная, спирт этиловый, спирт изопропиловый, смеси вышеуказанных веществ.

5. Фармацевтическая композиция по п. 1, которая может содержать пленочную оболочку в количестве от 0 до 3 мас. % от массы таблетки, в которой в качестве пленкообразующего могут быть использованы: полиэтиленгликоль, поливиниловый спирт, гидроксипропилцеллюлоза, гидроксиметилцеллюлоза и гидроксипропилметилцеллюлоза (Opadry YellowT, Colorcon Corp.), оксипропилметилцеллюлозы фталат, ацетилцеллюлозы фталат, поливинилацетата фталат, метилцеллюлозы фталат, сополимер метакриловой кислоты или сложные метиловые эфиры метакриловой кислоты (Eudragit R), этилцеллюлоза, ацетилцеллюлоза, сополимеры поливинилового спирта и малеинового ангидрида, полиэтиленгликоль (полиэтиленгликоль 6000), триэтилцитрат, диэтилфталат, пропиленгликоль, глицерин, бутилфталат, двуокись титана и красители, окись железа, алюминиевые красители, Опадрай II, Акрил-из, Колликут[®] МАЕ 100 D, Колликут[®] МАЕ 30D, Шюретерик, пленочные покрытия с сополимерами метакриловой кислоты, сополимеры этилакрилата и метилметакрилата.

6. Фармацевтическая композиция по п. 1, выполненная в виде твердых лекарственных форм: твердых желатиновых капсул, таблеток, гранул, порошка.

RU 2017123771 A

RU 2017123771 A