



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2004123612/15, 14.01.2003

(30) Приоритет: 15.01.2002 EP 02/000871.0

(43) Дата публикации заявки: 20.04.2005 Бюл. № 11

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 30.07.2004

(86) Заявка РСТ:
EP 03/00260 (14.01.2003)

(87) Публикация РСТ:
WO 03/05932 (27.07.2003)

Адрес для переписки:
119034, Москва, Пречистенский пер., 14, стр.1,
4-й эт., В.Н.Дементьеву

(71) Заявитель(и):
ЮСиБи ФАРШИМ С.А. (СН)

(72) Автор(ы):
ФАНАРА Доменико (ВЕ),
БЕРВАЕ Моник (ВЕ),
ГИШО Антони (ВЕ),
ДЕЛЕЕР Мишель (ВЕ)

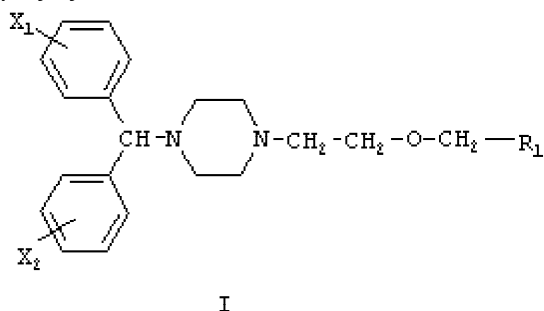
(74) Патентный поверенный:
Дементьев Владимир Николаевич

(54) ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ ПЕРОРАЛЬНОГО ПРИМЕНЕНИЯ

Формула изобретения

1. Фармацевтическая композиция для перорального применения, состоящая по крайней мере из двух разных рецептов:

первой рецептуры, которая включает активное вещество, выбранное из 2-[4-(дифенилметил)-1-пиперазинил]-уксусных кислот и их амидов, имеющих общую формулу I



где R₁ представляет собой -COOH группу или -CONH₂ группу, и

X₁ и X₂, рассматриваемые по отдельности, представляют собой атом водорода, атом галогена, прямую или разветвленную C₁-C₄ алкоксигруппу или трифторметильную группу,

а также их фармакологических приемлемых солей, геометрических изомеров, энантиомеров, диастереомеров и их комбинаций; причем первая рецептура не содержит полиолов имеющих молекулярную массу менее 300 в молярном соотношении между полиолами и активными веществами формулы I выше 10; и

второй рецептуры, которая включает один или более твердых полиолов с молекулярной массой менее 3000, и не содержит лекарственных веществ.

2. Композиция по п.1, в которой первая рецептура не содержит полиолов с молекулярной массой менее 950 в молярном соотношении между полиолом и активным веществом формулы I, превышающем 10, с исключением для лактозы.

3. Композиция по п.1, в которой первая рецептура не содержит полиолов с молекулярной массой менее 300 в молярном соотношении между полиолом и активным веществом формулы I, превышающем 5.

4. Композиция по любому из пп.1-3, в которой первая рецептура не содержит полиолов с молекулярной массой менее 300.

5. Композиция по любому из пп.1-3, в которой первая рецептура не содержит полиолов с молекулярной массой менее 950 в молярном соотношении между полиолом и активным веществом формулы I, превышающем 5, с исключением для лактозы.

6. Композиция по п.1, в которой первая рецептура не содержит полиолов с молекулярной массой менее 950, с исключением для лактозы.

7. Композиция по п.1, в которой рецептуры изготовлены в форме порошков, гранул, растворов или суспензий.

8. Композиция по п.1, в которой полиолом в составе второй рецептуры является маннит.

9. Композиция по п.1, в которой полиолом в составе второй рецептуры является полисахарид.

10. Композиция по п.1, в которой по крайней мере одна из рецептур содержит подщелачивающий агент.

11. Композиция по п.10, в которой подщелачивающим агентом является цитрат натрия.

12. Композиция по п.1, в которой первая рецептура дополнительно содержит один или более наполнителей, выбранный из циклодекстринов, безводной коллоидной двуокиси кремния, микрокристаллической целлюлозы, стеарата магния, ароматизаторов или красителей.

13. Композиция по п.1, в которой первая рецептура дополнительно содержит неполиоловые подсластители, такие как ацесульфам К, аспартам, сахарин, сахариновый натрий или цикламат.

14. Композиция по п.1, в которой активным веществом, на основе которого изготовлена первая рецептура, является дигидрохлорид цетиризина, дигидрохлорид левоцетиризина или дигидрохлорид эфлетиризина.

15. Композиция по п.1, в форме жевательной резинки, таблетки или шипучей таблетки.

16. Композиция по п.15 в форме многослойной таблетки, в которой каждый из слоев изготовлен на основе одной из рецептур.

17. Композиция по п.16 в форме многослойной таблетки, в которой слои, изготовленные на основе двух рецептур разделяет неактивный слой.

18. Композиция по п.15, представляющая собой таблетку, имеющую внутреннее ядро, изготовленное на основе первой рецептуры, и наружную оболочку, изготовленную на основе второй рецептуры.

19. Композиция по п.15, представляющая собой жевательную резинку, которая содержит: ядро, изготовленное на основе первой рецептуры и дополнительно содержащее жевательную основу, и оболочку, изготовленную на основе второй рецептуры.

20. Композиция по п.15, представляющая собой жевательную резинку, которая содержит ядро, изготовленное на основе второй рецептуры и дополнительно содержащее жевательную основу, и оболочку, изготовленную на основе первой рецептуры.

21. Композиция по п.1, представляющая собой сухой сироп, изготовленный из смеси двух типов гранул, причем один тип гранул изготовлен на основе первой рецептуры, а второй тип гранул - на основе второй рецептуры.

22. Способ изготовления фармацевтической композиции по любому из пп.1-21, заключающийся в отдельном изготовлении первой и второй рецептур и их смешивании.