



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21)(22) Заявка: 2014123435, 04.12.2012

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
04.12.2012

Дата регистрации:
21.02.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
05.12.2011 US 61/566,879

(45) Опубликовано: 21.02.2017 Бюл. № 6

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 07.07.2014

(86) Заявка РСТ:
US 2012/067763 (04.12.2012)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2013/085904 (13.06.2013)

Адрес для переписки:
190000, Санкт-Петербург, ВОХ-1125,
ПАТЕНТИКА

(72) Автор(ы):

БЕРГСТРОМ Дэвид (US),
ОПАВЭЙЛ Фой (US)

(73) Патентообладатель(и):

СУДА ЛИМИТЕД (AU)

(56) Список документов, цитированных в отчете
о поиске: US 2007/0031349 A1, 08.02.2007.
WO2001/035926 A2, 25.05.2001. WO2005/
077374 A1, 25.08.2005. WO2004/
019909, 17.02.2000. EA 10692 B1, 30.10.2008. EA
6242 B1, 27.10.2005.

(54) СОСТАВЫ В ФОРМЕ СПРЕЯ ДЛЯ ПЕРОРАЛЬНОГО ВВЕДЕНИЯ И СПОСОБЫ ВВЕДЕНИЯ СИЛДЕНАФИЛА

(57) Формула изобретения

1. Биодоступный состав в форме спрея для перорального введения для лечения легочной артериальной гипертензии и/или индуцированной селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (СИОЗС-индуцированной) сексуальной дисфункции, содержащий силденафил в форме его свободного основания или его фармацевтически приемлемую соль, при этом рН состава составляет от 1,5 до 2,4.

2. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 1, отличающийся тем, что силденафил в форме его свободного основания присутствует в количестве от 7 до 9% мас./об. из расчета на общее количество состава.

3. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 2, отличающийся тем, что силденафил в форме его свободного основания присутствует в количестве 8,31% мас./об. из расчета на общее количество состава.

4. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 1, отличающийся тем, что указанная соль силденафила присутствует в количестве от 10 до 12% мас./об. из расчета на общее количество состава.

5. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 4, отличающийся тем, что указанная соль силденафила присутствует в количестве 11,67% мас./об. из расчета на общее количество состава.
6. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 4 или 5, отличающийся тем, что указанная соль силденафила представляет собой силденафила цитрат.
7. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 1, отличающийся тем, что указанный состав содержит полярный растворитель.
8. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 7, отличающийся тем, что указанный полярный растворитель содержит пропиленгликоль и этиловый спирт.
9. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 8, отличающийся тем, что соотношение пропиленгликоль : этиловый спирт составляет 70:30% об./об., 65:35% об./об., 62,5:37,5% об./об., 60:40% об./об., 55:45% об./об. или 50:50% об./об.
10. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 1, отличающийся тем, что указанный состав содержит один или более регуляторов pH, выбранных из списка, включающего подкисляющие агенты, подщелачивающие агенты или их комбинации.
11. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 10, отличающийся тем, что указанный подкисляющий агент представляет собой соляную кислоту (HCl).
12. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 11, отличающийся тем, что HCl присутствует в количестве 10% об./об. из расчета на общее количество состава.
13. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 10, отличающийся тем, что указанный подщелачивающий агент представляет собой гидроксид натрия (NaOH).
14. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 13, отличающийся тем, что NaOH присутствует в количестве 2,1% об./об. из расчета на общее количество состава.
15. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 1, отличающийся тем, что указанный состав содержит агент, маскирующий вкус, и/или ароматизатор и/или подсластитель.
16. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 15, отличающийся тем, что указанный агент, маскирующий вкус, представляет собой мяту, и/или указанный ароматизатор представляет собой фруктовый и/или шоколадный ароматизатор, и/или указанный подсластитель представляет собой сукралозу.
17. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 1, отличающийся тем, что указанный состав содержит одно или более фармацевтически приемлемых вспомогательных веществ, носителей или их комбинацию.
18. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 1, отличающийся тем, что pH указанного состава составляет 2,2.
19. Состав в форме спрея для перорального введения по п. 1, отличающийся тем, что количество силденафила, вводимое за одно распыление, составляет от 10 до 30 мг.
20. Способ лечения легочной артериальной гипертензии и/или СИОЗС-индуцированной сексуальной дисфункции, включающий введение пациенту состава в форме спрея для перорального введения, содержащего силденафил в форме его свободного основания или его фармацевтически приемлемую соль, при этом pH состава составляет от 1,5 до 2,4.
21. Способ по п. 20, отличающийся тем, что силденафил в форме его свободного основания присутствует в количестве от 7 до 9% мас./об. из расчета на общее количество состава, и/или указанная соль силденафила присутствует в количестве от 10 до 12% мас./об. из расчета на общее количество состава.
22. Способ по п. 20, отличающийся тем, что указанная соль силденафила представляет собой силденафила цитрат.
23. Способ по п. 20, отличающийся тем, что указанный состав содержит полярный

растворитель.

24. Способ по п. 20, отличающийся тем, что указанный состав содержит один или более регуляторов pH, выбранных из списка, включающего подкисляющие агенты, подщелачивающие агенты или их комбинации.

25. Способ по п. 20, отличающийся тем, что количество силденафила, вводимое за одно распыление, составляет от 10 до 30 мг.

26. Способ по п. 20, отличающийся тем, что указанный состав содержит агент, маскирующий вкус, и/или ароматизатор, и/или подсластитель.

R U 2 6 1 1 4 0 3 C 1

R U 2 6 1 1 4 0 3 C 1