

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012106117/04, 19.07.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
21.07.2009 US 61/271,398

(43) Дата публикации заявки: 27.08.2013 Бюл. № 24

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 21.02.2012(86) Заявка РСТ:
US 2010/042428 (19.07.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/011318 (27.01.2011)

Адрес для переписки:

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

(71) Заявитель(и):

МАЙЛАН ИНК. (US)

(72) Автор(ы):

БЕЙРД Расселл Адам (US),
БАРНЕТТ Брэд Л. (US),
БЕСТЕ Расселл Д. (US)(54) **СПОСОБ НЕПРЕРЫВНОГО ПОЛУЧЕНИЯ ТРАНСДЕРМАЛЬНОГО ПЛАСТЫРЯ НА ОСНОВЕ ПОЛИИЗОБУТИЛЕНА**

(57) Формула изобретения

1. Способ получения адгезивной композиции без использования растворителя, включающий:

а) подачу высокомолекулярного полиизобутилена (ВММ PIB) в экструдирующее устройство, где указанный высокомолекулярный полиизобутилен, по существу, не содержит наполнители, растворители и пластификаторы;

б) смешивание указанного ВММ PIB с низкомолекулярным полиизобутиленом (НММ PIB) в указанном экструдирующем устройстве для образования расплава, не содержащего, по существу, наполнители, растворители и пластификаторы;

с) добавление активного фармацевтического ингредиента (API) к указанному расплаву для получения расплава API/PIB и

д) пропускание указанного расплава API/PIB через головку для образования указанной адгезивной композиции, не содержащей, по существу, наполнители, растворители и пластификаторы.

2. Способ по п.1, где указанный высокомолекулярный полиизобутилен предварительно обрабатывают в одношнековом экструдере перед подачей в указанное экструдирующее устройство.

3. Способ по п.2, где указанный одношнековый экструдер нагревают до температуры приблизительно от 85 до приблизительно 500°F.

4. Способ по п.1, где указанный высокомолекулярный полиизобутилен имеет

молекулярную массу приблизительно от 100000 до приблизительно 800000 г/моль.

5. Способ по п.1, где указанный высокомолекулярный полиизобутилен имеет молекулярную массу приблизительно от 200000 до приблизительно 425000 г/моль.

6. Способ по п.1, где указанный ВММ PIB и указанный НММ PIB смешивают в двухшнековом экструдере.

7. Способ по п.1, где указанный низкомолекулярный полиизобутилен имеет молекулярную массу приблизительно от 35000 до приблизительно 100000 г/моль.

8. Способ по п.1, где указанный низкомолекулярный полиизобутилен имеет молекулярную массу приблизительно от 36000 до приблизительно 75000 г/моль.

9. Способ по п.1, где указанный низкомолекулярный полиизобутилен нагревают до температуры приблизительно от 65 до приблизительно 500°F.

10. Способ по п.1, где соотношение указанного высокомолекулярного полиизобутилена и указанного низкомолекулярного полиизобутилена находится приблизительно от 20:80 до приблизительно 85:15.

11. Способ по п.1, где указанный активный фармацевтический ингредиент выбирают из группы, состоящей из антагониста опиоидного рецептора, анестезирующих средств, местных анестезирующих средств, противоастматических средств, противовоспалительных веществ, опиатов, бронхолитических средств, анальгетиков, противогипертензивных лекарственных средств, гормонов, контрацептивных средств, средств против тошноты, антигистаминных средств, стимуляторов, лекарственных средств против стенокардии, агонистов опиатного рецептора, агонистов дофамина, антихолинергических средств, лекарственных средств нервно-мышечного действия, анаболических лекарственных средств, противорвотных средств, противоотечных средств, сосудосуживающих средств, седативных средств, психотропных средств, диуретических средств, сосудорасширяющих средств, снотворных средств, жаропонижающих средств и противоспазматических средств.

12. Способ по п.1, где указанный активный фармацевтический ингредиент выбирают из группы, состоящей из лидокаина, пироксикама, фентанила, суфентанила, албутерола, бупренорфина, клонидина, диклофенака, эстрадиола, этинилэстрадиола, гранисетрона, кетопрофена, лоратидина, мемантина, метилфенидата, налтрексона, никотина, нитроглицерина, норелгестромина оксibuтини́на, рисперидона, ривастигмина, ротигатина, скополамина, селегилина, тестостерона, деслоратидина, дексметилфенидата и тулобутерола.

13. Способ по п.1, где количество указанного активного фармацевтического ингредиента в указанной композиции находится приблизительно от 0,01 до приблизительно 40 мас.% указанного расплава API/PIB.

14. Способ по п.1, дополнительно включающий добавление одной или более добавок к указанному расплаву API/PIB.

15. Способ по п.1, дополнительно включающий ламинирование указанной адгезивной композиции между защитным слоем и высвобождающей прокладкой для получения устройства для трансдермальной доставки.

16. Адгезивная композиция, не содержащая наполнители, полученная в соответствии со способом по п.1.

17. Адгезивная композиция по п.16, где указанный API выбирают из группы, состоящей из лидокаина, пироксикама, фентанила и суфентанила.

18. Способ получения адгезивной композиции без использования растворителя, включающий:

а) подачу высокомолекулярного полиизобутилена (ВММ PIB), имеющего молекулярную массу приблизительно от 100000 до приблизительно 800000 г/моль, в двухшнековое экструдировующее устройство, где указанный высокомолекулярный

полиизобутилен, по существу, не содержит наполнители, растворители и пластификаторы;

б) смешивание указанного ВММ РІВ с низкомолекулярным полиизобутиленом (НММ РІВ) в указанном экструдирующем устройстве для образования расплава, не содержащего, по существу, наполнители, растворители и пластификаторы; где указанный НММ РІВ имеет молекулярную массу приблизительно от 35000 до приблизительно 100000 г/моль и где соотношение количества ВММ РІВ и НММ РІВ в указанном расплаве находится приблизительно от 20:80 до приблизительно 85:15;

с) добавление активного фармацевтического ингредиента к указанному расплаву для получения расплава АРІ/РІВ и

д) пропускание указанного расплава АРІ/РІВ через головку для образования указанной адгезивной композиции, не содержащей, по существу, наполнители, растворители и пластификаторы.

19. Способ по п.18, где указанный ВММ РІВ имеет среднечисловую молекулярную массу, равную приблизительно 250000, указанный НММ РІВ имеет среднечисловую молекулярную массу, равную приблизительно 51000, и указанный АРІ представляет собой лидокаин.

RU 2012106117 A

RU 2012106117 A