



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ(21), (22) Заявка: **2007142454/15, 16.11.2007**(30) Конвенционный приоритет:
14.04.2003 US 60/462,808(43) Дата публикации заявки: **27.05.2009** Бюл. № 15(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,
из которой данная заявка выделена:
2005135135 11.11.2005Адрес для переписки:
**129090, Москва, ул.Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры", пат.пов. А.В.Мишу**

(71) Заявитель(и):

УАЙТ ХОЛДИНГЗ КОРПОРЕЙШН (US)

(72) Автор(ы):

**КОХЕН Джонатан Марк (US),
ШАХ Саед Музафар (US),
ОФСЛЭЙГЕР Кристиан Лютер (US),
ФАВЗИ Махди Бакир (US)****(54) КОМПОЗИЦИИ, СОДЕРЖАЩИЕ ПИПЕРАЦИЛЛИН И ТАЗОБАКТАМ, ПРИМЕНИМЫЕ
ДЛЯ ИНЪЕКЦИИ****(57) Формула изобретения**

1. Фармацевтическая композиция для лечения или контроля бактериальных инфекций путем парентерального введения, содержащая эффективные количества (a) пиперациллина или его фармацевтически приемлемой соли, (b) тазобактама или его фармацевтически приемлемой соли и хелатообразующий агент, представляющий собой аминокарбоновую кислоту или ее фармацевтически приемлемую соль.

2. Фармацевтическая композиция по п.1, дополнительно содержащая буфер, адаптированный для поддержания pH в диапазоне от 6,0 до 7,5, предпочтительно на уровне в основном 6,5.

3. Фармацевтическая композиция по п.2, в которой буфер представляет собой цитрат.

4. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая натриевую соль пиперациллина, натриевую соль тазобактама и хелатообразующий агент, представляющий собой натриевую соль аминокарбоновой кислоты.

5. Фармацевтическая композиция по п.4, дополнительно содержащая цитрат натрия в качестве буфера.

6. Фармацевтическая композиция по п.1, в которой хелатообразующий агент представляет собой по меньшей мере одну аминокарбоновую кислоту, выбранную из группы, состоящей из этилендиаминтетрауксусной кислоты (EDTA), диэтилентриаминпентауксусной кислоты (DTPA), гидроксипентадиаминтриуксусной кислоты (HEDTA), нитрилотриуксусной кислоты (NTA), о,о'-бис-(2-аминоэтил)этиленгликоль-N,N,N',N'-тетрауксусной кислоты (EGTA),

транс-1,2-диаминоциклогексан-N,N,N',N'-тетрауксусной кислоты (СуДТА) и их фармацевтически приемлемых солей.

7. Фармацевтическая композиция по п.6, в которой хелатообразующий агент, представляющий собой этилендиаминтетрауксусную кислоту (EDTA) или ее фармацевтически приемлемую соль.

8. Фармацевтическая композиция по п.1, дополнительно содержащая аминогликозид.

9. Фармацевтическая композиция по п.8, в которой аминогликозид выбран из амикацина и тобрамицина.

10. Фармацевтическая композиция по п.1, в форме порошка, которая может быть восстановлена перед парентеральным введением путем добавления совместимого с восстановлением разбавителя.

11. Фармацевтическая композиция по п.1 в форме замороженной композиции, адаптированной для разморозки и, если требуется, разбавления совместимым разбавителем перед парентеральным введением.

12. Фармацевтическая композиция по п.1 в форме готовой для применения для парентерального введения.

13. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-12 в форме раствора.

14. Фармацевтическая композиция по п.13, в которой концентрация пиперациллина находится в диапазоне приблизительно от 8 до приблизительно 500 мг/мл раствора, концентрация цитратного буфера находится в диапазоне от 0,25 до 25 мг/мл раствора, и концентрация тазобактама находится в диапазоне от 0,1 до 125 мг/мл раствора.

15. Фармацевтическая композиция по п.1, дополнительно содержащая эффективное количество декстрозы для перевода композиции в физиологически изоосмотическое состояние.

16. Фармацевтическая композиция по п.13, дополнительно содержащая декстрозу в диапазоне приблизительно от 5 до приблизительно 100 мг/мл раствора, и содержащая амикацин в диапазоне от 0,1 до 75 мг/мл раствора и тобрамицин в диапазоне от 0,1 до 75 мг/мл.

17. Фармацевтическая композиция по п.13, в которой хелатообразующий агент, представляющий собой аминокарбоновую кислоту или ее фармацевтически приемлемую соль, находится в диапазоне приблизительно от 0,002 до приблизительно 10 мг/мл, предпочтительно в диапазоне приблизительно 0,003 до приблизительно 1 мг/мл.

18. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, в которой указанная фармацевтическая композиция представляет собой концентрат для приготовления доз в герметичном контейнере, где в упомянутом контейнере имеется пространство, достаточное для введения объема водного растворителя, достаточного для образования концентрированного раствора указанной фармацевтической композиции.

19. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, где указанная фармацевтическая композиция в виде жидкости для внутривенного введения для лечения бактериальных инфекций содержится в IV-упаковке или IV-флаконе для стандартной дозы.

20. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая (а) пиперациллин или его фармацевтически приемлемую соль, в основном, в количестве 4,0 г в пересчете на пиперациллин в форме свободной кислоты, (b) тазобактам или его фармацевтически приемлемую соль, в основном, в количестве 0,5 г в пересчете на тазобактам в форме свободной кислоты, (с) по существу, 1 мг EDTA или фармацевтически приемлемой соли EDTA и (d) по существу, 100 мл воды для инъекции.

21. Фармацевтическая композиция в форме порошка, которая может быть восстановлена перед парентеральным введением путем добавления совместимого с

восстановлением разбавителя для образования композиции по п.20.

22. Фармацевтическая композиция по п.20 в форме замороженной композиции, адаптированной к разморозке и, если требуется, к разбавлению совместимым разбавителем перед парентеральным введением.

23. Способ приготовления фармацевтической композиции, применимой для лечения и контроля бактериальных инфекций путем парентерального введения, указанная фармацевтическая композиция представлена в форме порошка, который можно восстанавливать перед парентеральным введением путем добавления совместимого с восстановлением разбавителя, или в форме замороженной композиции, адаптированной для разморозки и, если требуется, для разбавления совместимым разбавителем перед парентеральным введением; способ включает заморозку или лиофилизацию раствора, содержащего эффективные количества (а) пиперациллина или его фармацевтически приемлемой соли, (b) тазобактама или его фармацевтически приемлемой соли и хелатообразующего агента, представляющего собой аминокарбоновую кислоту или ее фармацевтически приемлемую соль, в водном носителе.

24. Способ лечения или контроля бактериальных инфекций у млекопитающего, включающий парентеральное введение указанному млекопитающему терапевтически эффективного количества фармацевтической композиции по п.12.

25. Способ лечения и контроля бактериальных инфекций у млекопитающего, включающий совместное парентеральное введение указанному млекопитающему терапевтически эффективного количества фармацевтической композиции по п.12 и аминогликозида.

RU 2007142454 A

RU 2007142454 A