

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202091610** (13) **A2**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ**

(43) Дата публикации заявки
2021.02.26

(51) Int. Cl. *A61K 31/192* (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2020.07.29

(54) **ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ, СОДЕРЖАЩИЕ ФЕНОЗАНОВУЮ КИСЛОТУ**

(31) 2019124100

(72) Изобретатель:

(32) 2019.07.30

Ким Галина Александровна, Лапик

(33) RU

Иван Валерьевич, Хмельщиков Юрий

(71) Заявитель:

Владимирович (RU)

**ОБЩЕСТВО С ОГРАНИЧЕННОЙ
ОТВЕТСТВЕННОСТЬЮ
"КОНСОРЦИУМ-ПИК" (RU)**

(74) Представитель:

Кравченко А.А. (RU)

(57) Изобретение относится к фармацевтическим композициям фенозановой кислоты и может быть использовано в качестве лекарственного препарата. Технической задачей, решаемой заявленным изобретением, является создание впервые фармацевтической композиции в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту. Техническим результатом, достигаемым при реализации заявленного изобретения, является создание впервые фармацевтической композиции в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту, и таким образом расширение арсенала противосудорожных средств, обладающих ноотропным действием. Технический результат достигается за счет того, что фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержит в мг на одну капсулу: фенозановую кислоту или ее фармацевтически приемлемую соль - 100-200; наполнитель - 10-280; связующее - 2-100; смазывающее - 0,1-5,0; разрыхлитель - 0,5-100.

A2

202091610

202091610

A2

ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ, СОДЕРЖАЩИЕ ФЕНОЗАНОВУЮ КИСЛОТУ

5 [0001]ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ

[0002]Предложенное техническое решение относится к фармацевтическим композициям фенозановой кислоты и может быть использовано в качестве лекарственного препарата.

[0003]УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

10 [0004]Из уровня техники неизвестно лекарственное средство в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей в качестве активного вещества фенозановую кислоту.

[0005]РАСКРЫТИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

15 [0006] Технической задачей, решаемой заявленным изобретением, является создание впервые фармацевтической композиции в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту.

20 [0007] Техническим результатом, достигаемым при реализации заявленного изобретения, является создание впервые фармацевтической композиции в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту, и таким образом расширение арсенала противозепилептических средств, обладающих ноотропным действием.

[0008]Технический результат достигается за счет того, что фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержит в мг на одну капсулу:

25	фенозановую кислоту	
	или ее фармацевтически приемлемую соль	100-200;
	наполнитель	10-280;
	связующее	2-100;
	смазывающее	0,1-5,0;
30	разрыхлитель	0,5-100.

[0009]ОСУЩЕСТВЛЕНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

[0010]Далее приводятся варианты осуществления настоящего изобретения, раскрывающие примеры его реализации в частных исполнениях. Тем не менее, само описание не предназначено для ограничения объема прав, предоставляемых данным

патентом. Скорее, следует исходить из того, что заявленное изобретение также может быть осуществлено другими способами таким образом, что будет включать в себя отличающиеся элементы и условия или комбинации элементов и условий, аналогичных элементам и условиям, описанным в данном документе, в сочетании с другими существующими и будущими технологиями.

[0011] В предпочтительном варианте осуществления настоящего изобретения обеспечивается фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержащая в мг на одну капсулу:

10	фенозановую кислоту	
	или ее фармацевтически приемлемую соль	100-200;
	наполнитель	10-280;
	связующее	2-100;
	смазывающее	0,1-5,0;
15	разрыхлитель	0,5-100.

[0012] В частном варианте осуществления настоящего изобретения обеспечивается фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержащая в мг на одну капсулу:

20	фенозановую кислоту	
	или ее фармацевтически приемлемую соль	100-200;
	<i>в качестве наполнителя:</i>	
	крахмал картофельный	10-50;
	или крахмал прежелатинизированный,	
25	или МКЦ, или целлюлозу порошкообразную	10-280;
	или лактозы моногидрат, или соль кальция (карбонат, фосфат двузамещенный, сульфата дигидрат), или магния карбонат основной	15-150;
	или магния окись;	15-100;
30	или маннитол	10-70;
	<i>в качестве разрыхлителя:</i>	
	крахмал пшеничный	10-100;
	или крахмал картофельный, или	
	крахмал кукурузный, или крахмал рисовый	10-75;

	или метилцеллюлозу	2-25;
	или натрия карбоксиметилцеллюлозу	2-45;
	или натрия крахмала гликолят, или натрий-кроскармеллозу, или кросповидон	2-70;
5	или производные альгиновой кислоты (калия и натрия альгинаты)	1-25;
	или Твин-80	0,5-5,0;
	или натрия лаурилсульфат	1-15;
	<i>в качестве связующего:</i>	
10	крахмал частично прежелатинизированный или поливинилпирролидон;	10-50;
	или гидроксипропилметилцеллюлозу или гидроксипропилцеллюлозу;	2-25;
	или лактозу безводную;	20-100;
15	или коповидон	2-50;
	<i>в качестве смазывающего:</i>	
	стеариновую кислоту или ее соль, в том числе, не ограничиваясь: кальция стеарат, или магния стеарат	0,25-5,0;
20	или натрия лаурилсульфат, взятый в количестве от 0,5 до 2 частей в совокупности со стеариновой кислотой или ее солями, взятыми в количестве от 1 до 10 частей, причем натрия лаурилсульфат взят в меньшем количестве, чем стеариновая кислота или ее соль	0,1-2;
25	или глицерил бегенат, или натрия стеарилфумарат	0,1-5,0.
	[0013] В частном варианте осуществления настоящего изобретения обеспечивается фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержащая в мг на одну капсулу:	
30	фенозановую кислоту	
	или ее фармацевтически приемлемую соль	100-200;
	в качестве наполнителя: лактозы моногидрат	15-150;
	в качестве разрыхлителя: крахмал картофельный	10-75;
	в качестве связующего: коповидон	2-50;

в качестве смазывающего: кальция стеарат 0,1-5,0.

[0014] В частном варианте осуществления настоящего изобретения обеспечивается фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержащая в мг на
5 одну капсулу:

фенозановую кислоту
или ее фармацевтически приемлемую соль 100;
в качестве наполнителя: лактозы моногидрат 38;
в качестве разрыхлителя: крахмал картофельный 21;
10 в качестве связующего: коповидон 5;
в качестве смазывающего: кальция стеарат 1.

[0015] В частном варианте осуществления настоящего изобретения обеспечивается фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержащая в мг на
15 одну капсулу:

фенозановую кислоту
или ее фармацевтически приемлемую соль 150;
в качестве наполнителя: лактозы моногидрат 57;
в качестве разрыхлителя: крахмал картофельный 31,5;
20 в качестве связующего: коповидон 7,5;
в качестве смазывающего: кальция стеарат 1,5.

[0016] В частном варианте осуществления настоящего изобретения обеспечивается фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержащая в мг на
25 одну капсулу:

фенозановую кислоту
или ее фармацевтически приемлемую соль 200;
в качестве наполнителя: лактозы моногидрат 76;
в качестве разрыхлителя: крахмал картофельный 42;
30 в качестве связующего: коповидон 10;
в качестве смазывающего: кальция стеарат 2.

[0017] Термин «наполнитель» означает вещества, добавляемые к основному составу для обеспечения требуемой массы содержимого лекарственной формы, в частности, капсулы. В рамках настоящего изобретения в качестве наполнителя может

быть использовано одно из или комбинация из, не ограничиваясь: крахмал картофельный, крахмал прежелатинизированный, лактозы моногидрат, магния карбонат основной, магния окись, соли кальция (карбонат кальция, фосфат кальция двузамещенный, сульфата дигидрат кальция), МКЦ, целлюлоза порошкообразная, маннитол.

5 [0018] Термин «связующее» означает вещества, добавляемые к основному составу для достижения необходимой силы сцепления между частицами. в рамках настоящего изобретения в качестве связующего может быть использовано одно из или комбинация из, не ограничиваясь: крахмал частично прежелатинизированный, лактоза безводная, поливинилпирролидон, коповидон, гидроксипропилметилцеллюлоза, гидроксипропилцеллюлоза.

10 [0019] Термин «смазывающее» означает вещества, добавляемые к основному составу для уменьшения трения между частицами, а также частиц с поверхностью оборудования. В рамках настоящего изобретения в качестве смазывающего может быть использовано одно из или комбинация из, не ограничиваясь: стеариновая кислота или ее соль, в том числе, не ограничиваясь: кальция стеарат, или магния стеарат; натрия лаурилсульфат, взятый в количестве от 0,5 до 2 частей в совокупности со стеариновой кислотой или ее солями, взятыми в количестве от 1 до 10 частей, причем натрия лаурилсульфат взят в меньшем количестве, чем стеариновая кислота или ее соль; глицерил бегенат (моно-, ди- триглицериды бегеновой кислоты); натрия стеарилфумарат.

15 [0020] Термин «разрыхлитель» означает вещества, добавляемые к основному составу для улучшения распадаемости и/или растворения. В рамках настоящего изобретения в качестве разрыхлителя может быть использовано одно из или комбинация из, не ограничиваясь: крахмал пшеничный, крахмал картофельный, крахмал кукурузный, крахмал рисовый, метилцеллюлоза, натрия карбоксиметилцеллюлоза, натрия крахмала гликолят, натрий-кроскармеллоза, кросповидон, производные альгиновой кислоты (калия и натрия альгинаты), твин-80, натрия лаурилсульфат.

20 [0021] Заявленная фармацевтическая композиция изготавливается известными из уровня техники методами в следующих вариантах при содержании компонентов в мг на одну капсулу и при составе капсул, например, не ограничиваясь: титана диоксид, оксид железа желтый, желатин.

[0022] Таблица № 1

Вещество	min, мг на капсулу	mid, мг на капсулу	max, мг на капсулу
фенозановая кислота или ее фармацевтически приемлемая соль	100	150	200
наполнитель:			
крахмал картофельный; или	10	30	50
крахмал прежелатинизированный, или МКЦ, или целлюлоза порошкообразная; или	10	150	280
лактозы моногидрат, или соль кальция (карбонат, фосфат двузамещенный, сульфата дигидрат), или магния карбонат основной; или	15	75	150
магния окись; или	15	60	100
маннитол;	10	35	70
связующее:			
крахмал частично прежелатинизированный или поливинилпирролидон; или	10	30	50
гидроксипропилметилцеллюлоза или гидроксипропилцеллюлоза; или	2	15	25
лактоза безводная; или	20	60	100
коповидон	2	30	50
смазывающее:			
стеариновая кислота или ее соль, в том числе, не ограничиваясь: кальция стеарат, или магния стеарат; или	0,25	3	4,5
натрия лаурилсульфат, взятый в количестве от 0,5 до 2 частей в совокупности со стеариновой кислотой или ее солями, взятыми в количестве от 1 до 10 частей, причем натрия лаурилсульфат взят в меньшем количестве, чем стеариновая кислота или ее соль; или	0,1	1,5	2
глицерил бегенат, или натрия стеарилфумарат	0,1	3	5,0
разрыхлитель:			
крахмал пшеничный; или	10	50	100
крахмал картофельный, или крахмал кукурузный, или крахмал рисовый; или	10	50	75
метилцеллюлоза; или	2	15	25

натрия карбоксиметилцеллюлоза; или	2	20	45
натрия крахмала гликолят, или натрий-кроскармеллоза, или кросповидон; или	2	40	70
производные альгиновой кислоты (калия и натрия альгинаты); или	1	15	25
Твин-80; или	0,5	3	5,0
Натрия лаурилсульфат	1	9	15

[0023] В предпочтительном варианте осуществления заявленная твердая желатиновая капсула фенозановой кислоты содержит следующие компоненты в мг на одну капсулу при составе капсул, например, не ограничиваясь: титана диоксид, оксид железа желтый, желатин.

5 [0024] Таблица № 2

Вещество	min, мг на капсулу	mid, мг на капсулу	max, мг на капсулу
фенозановая кислота или ее фармацевтически приемлемая соль	100	150	200
наполнитель:			
лактозы моногидрат	38	57	76
связующее:			
коповидон	5	7,5	10
смазывающее:			
кальция стеарат	1	1,5	2
разрыхлитель:			
крахмал картофельный	21	31,5	42

[0025] Настоящее описание осуществления заявленного изобретения демонстрирует лишь частные варианты осуществления и не ограничивает иные варианты реализации заявленного изобретения, поскольку возможные иные альтернативные варианты осуществления заявленного изобретения, не выходящие за пределы объема информации, изложенной в настоящей заявке, должны быть очевидными для специалиста в данной области техники, имеющим обычную квалификацию, на которого рассчитано заявленное изобретение.

10

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Фармацевтическая композиция в виде твердой желатиновой капсулы, содержащей фенозановую кислоту и вспомогательные вещества, содержащая в мг на одну капсулу:

фенозановую кислоту	
или ее фармацевтически приемлемую соль	100-200;
наполнитель	10-280;
связующее	2-100;
смазывающее	0,1-5,0;
разрыхлитель	0,5-100.

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, характеризующаяся тем, что, содержит в мг на одну капсулу:

фенозановую кислоту	
или ее фармацевтически приемлемую соль	100-200;
<i>в качестве наполнителя:</i>	
крахмал картофельный	10-50;
или крахмал прежелатинизированный, или МКЦ, или целлюлозу порошкообразную	10-280;
или лактозы моногидрат, или соль кальция (карбонат, фосфат двузамещенный, сульфата дигидрат), или магния карбонат основной	15-150;
или магния окись;	15-100;
или маннитол	10-70;
<i>в качестве разрыхлителя:</i>	
крахмал пшеничный	10-100;
или крахмал картофельный, или крахмал кукурузный, или крахмал рисовый	10-75;
или метилцеллюлозу	2-25;
или натрия карбоксиметилцеллюлозу	2-45;
или натрия крахмала гликолят, или натрий-кроскармеллозу, или кросповидон	2-70;
или производные альгиновой кислоты (калия и натрия альгинаты)	1-25;

или Твин-80	0,5-5,0;
или натрия лаурилсульфат	1-15;
<i>в качестве связующего:</i>	
крахмал частично прежелатинизированный или поливинилпирролидон;	10-50;
или гидроксипропилметилцеллюлозу или гидроксипропилцеллюлозу;	2-25;
или лактозу безводную;	20-100;
или коповидон	2-50;
<i>в качестве смазывающего:</i>	
стеариновую кислоту или ее соль, в том числе, не ограничиваясь: кальция стеарат, или магния стеарат	0,25-5,0;
или натрия лаурилсульфат, взятый в количестве от 0,5 до 2 частей в совокупности со стеариновой кислотой или ее солями, взятыми в количестве от 1 до 10 частей, причем натрия лаурилсульфат взят в меньшем количестве, чем стеариновая кислота или ее соль	0,1-2;
или глицерила бегенат, или натрия стеарилфумарат	0,1-5,0.
3. Фармацевтическая композиция по любому из п.п. 1 или 2, характеризующаяся тем, что содержит в мг на одну капсулу:	
фенозановую кислоту	
или ее фармацевтически приемлемую соль	100-200;
в качестве наполнителя: лактозы моногидрат	15-150;
в качестве разрыхлителя: крахмал картофельный	10-75;
в качестве связующего: коповидон	2-50;
в качестве смазывающего: кальция стеарат	0,1-5,0.
4. Фармацевтическая композиция по п. 3, характеризующаяся тем, что содержит в мг на одну капсулу:	
фенозановую кислоту	
или ее фармацевтически приемлемую соль	100;
в качестве наполнителя: лактозы моногидрат	38;
в качестве разрыхлителя: крахмал картофельный	21;
в качестве связующего: коповидон	5;

в качестве смазывающего: кальция стеарат 1.

5. Фармацевтическая композиция по п. 3, характеризующаяся тем, что содержит в мг на одну капсулу:

фенозановую кислоту	
или ее фармацевтически приемлемую соль	150;
в качестве наполнителя: лактозы моногидрат	57;
в качестве разрыхлителя: крахмал картофельный	31,5;
в качестве связующего: коповидон	7,5;
в качестве смазывающего: кальция стеарат	1,5.

6. Фармацевтическая композиция по п. 3, характеризующаяся тем, что содержит в мг на одну капсулу:

фенозановую кислоту	
или ее фармацевтически приемлемую соль	200;
в качестве наполнителя: лактозы моногидрат	76;
в качестве разрыхлителя: крахмал картофельный	42;
в качестве связующего: коповидон	10;
в качестве смазывающего: кальция стеарат	2.