



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012126084/15, 23.11.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
23.11.2009 IN 2703/MUM/2009

(43) Дата публикации заявки: 27.12.2013 Бюл. № 36

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 25.06.2012(86) Заявка РСТ:
GB 2010/002164 (23.11.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/061519 (26.05.2011)

Адрес для переписки:

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

(71) Заявитель(и):

СИПЛА ЛИМИТЕД (IN)

(72) Автор(ы):

**ЛУЛЛА Амар (IN),
МАЛХОТРА Джина (IN)****(54) ПЕННАЯ КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ МЕСТНОГО ПРИМЕНЕНИЯ****(57) Формула изобретения**

1. Фармацевтическая композиция для местного ректального введения в форме пены, содержащая рифаксимин.

2. Композиция по п.1, дополнительно содержащая водный или неводный носитель.

3. Композиция по п.2, в которой неводный носитель является одним или более фармацевтически приемлемыми алканолами; одним или более фармацевтически приемлемыми растительными маслами; или одним или более фармацевтически приемлемыми органическими сложными эфирами.

4. Композиция по п.3, в которой растворимый в воде алканол является этанолом; пропиленгликолем; глицерином; полиэтиленгликолем; полипропиленгликолем; пропиленгликолем; глицероловым сложным эфиром; или смесью вышеперечисленного.

5. Композиция по пп.2, 3 или 4, в которой носитель содержит растворимый в воде алканол и воду, и в которой массовое отношение растворимого в воде алканола к воде составляет от 0,05:10 до 10:0,05.

6. Композиция по п.1, в которой носитель составляет от 10% масс. до 90% масс. от общей массы композиции.

7. Композиция по п.1, в которой носитель включает воду в количестве от 20% масс. до 90% масс. от общей массы композиции, и растворимый в воде алканол в количестве от 0% масс. до 50% масс. от общей массы композиции.

8. Композиция по п.1, дополнительно содержащая по меньшей мере одно

поверхностно-активное вещество.

9. Композиция по п.8, в которой поверхностно-активное вещество присутствует в количестве от 0,1 до 1,0% масс. от общей массы композиции.

10. Композиция по п.1, дополнительно содержащая по меньшей мере один пропеллент.

11. Композиция по п.10, в которой пропеллент присутствует в количестве от 0,5 до 20% масс. от общей массы композиции.

12. Композиция по п.1, дополнительно содержащая по меньшей мере один солиubilизатор.

13. Композиция по п.1, дополнительно содержащая по меньшей мере один эмульгатор.

14. Композиция по п.13, в которой эмульгатор присутствует в количестве от 1 до 15% масс. от общей массы композиции.

15. Композиция по п.1, дополнительно содержащая по меньшей мере один антиоксидант.

16. Композиция по п.1, дополнительно содержащая по меньшей мере один консервант.

17. Композиция по п.16, в которой консервант присутствует в количестве от 0,1 до 0,2% масс. от общей массы композиции.

18. Композиция по п.1, дополнительно содержащая силикон.

19. Композиция по п.1, содержащая от 0,01 до 10% масс. рифаксимины от общей массы композиции.

20. Композиция по п.1, которая не содержит минерального масла.

21. Композиция по п.1, в которой композиция дополнительно включает 5-ацетилсалициловую кислоту (5-ASA), сульфасалазин, асалазин, преднизолон или будесонид.

22. Фармацевтическая композиция для местного ректального введения в форме пены, содержащая следующие компоненты в % по массе:

Рифаксимин	0,01-10%
Пропиленгликоль	10,0-40,0%
Эмульсионный воск	1,0-10,0%
Цетиловый спирт	0,1-5,0%
Полиоксиэтилен 10 стеариловый эфир	0,1-1,0%
Метилпарабен	0,1-0,18%
Пропилпарабен	0,01-0,02%
Триэтаноламин	0,5-5,0%
Очищенная вода	20,0-80,0%
Углеводородный пропеллент (пропан/н-бутан/изобутан)	0,5-10,0%

23. Фармацевтическая композиция по п.1, для введения в прямую кишку, толстую кишку и/или в терминальный отдел подвздошной кишки пациента для лечения, профилактики или поддержания ремиссии заболевания прямой кишки, толстой кишки, терминального отдела подвздошной кишки или заднего прохода.

24. Применение фармацевтической композиции, как определено в любом из пп.1-22, для изготовления лекарственного средства для введения в прямую кишку, толстую кишку и/или в терминальный отдел подвздошной кишки пациента для лечения, профилактики или поддержания ремиссии заболевания прямой кишки, толстой кишки, терминального отдела подвздошной кишки или заднего прохода.

25. Способ лечения, предотвращения или облегчения расстройства прямой кишки, толстой кишки, терминального отдела подвздошной кишки или заднего прохода, включающий введение эффективного количества фармацевтической композиции согласно любому из пп.1-22 нуждающемуся в этом субъекту.

26. Способ получения фармацевтической композиции, содержащей рифаксимин, включающий:

(1) нагревание смеси эмульгатора и поверхностно-активного вещества для образования масляной фазы;

(2) отдельное нагревание смеси консерванта и воды;

(3) добавление растворимого в воде алканола к смеси консервант-водная смесь и затем смешивание с масляной фазой стадии (1); и

(4) добавление рифаксимины к смеси, образовавшейся на стадии (3), и доведение pH до требуемого значения с использованием агента для регулирования pH.

27. Способ по п.26, дополнительно включающий нагревание эмульсионного воска с эмульгатором и поверхностно-активным веществом на стадии (1).

28. Способ по п.26 или 27, дополнительно включающий необязательное добавление очищенной воды к продукту стадии (4), затем заполнение продукта в диспенсер и зарядку диспенсера пропеллентом.

29. Способ по п.26, в котором рифаксимин находится в микронизированной форме.

30. Способ по п.26, в котором размер частиц рифаксимины составляет меньше, чем около 200 микрон.

31. Применение силикона в качестве лубриканта и стабилизатора в композиции ректальной формы, содержащей рифаксимин.

32. Диспенсер для фармацевтической композиции, как определено в любом из пп.1-22, содержащий герметичный баллончик, содержащий фармацевтическую композицию под давлением; дозирующий клапан для измерения отмеряемой дозы композиции из герметичного баллончика для введения нуждающемуся в этом пациенту; и пусковой механизм для точного выпуска отмеряемой дозы композиции пациенту в форме пены.

33. Диспенсер по п.31, в котором отмеряемая доза содержит от 0,5 г до 10 г фармацевтической композиции.

34. Фармацевтическая композиция по п.22, для введения в прямую кишку, толстую кишку и/или в терминальный отдел подвздошной кишки пациента для лечения, профилактики или поддержания ремиссии заболевания прямой кишки, толстой кишки, терминального отдела подвздошной кишки или заднего прохода.