



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **80535** (13) **U**
(51) МПК (2013.01)
A61K 31/00

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: u 2012 09407	(72) Винахідник(и): Черкашина Юлія Олександрівна (UA)
(22) Дата подання заявки: 01.08.2012	(73) Власник(и): Черкашина Юлія Олександрівна, вул. Кронштадська, 8, м. Харків, 61110 (UA)
(24) Дата, з якої є чинними права на корисну модель: 10.06.2013	(74) Представник: Якобчук Олена Миколаївна, реєстр. №268
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 10.06.2013, Бюл.№ 11	

(54) ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ СЕКСУАЛЬНОЇ ДИСФУНКЦІЇ

(57) Реферат:

Фармацевтична композиція для лікування сексуальної дисфункції, яка містить дапоксетин або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір, та принаймні одну фармацевтично прийнятну допоміжну речовину, яка відрізняється тим, що додатково містить тадалафіл або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір, додатково містить двохосновний кальцію фосфат, причому при виготовленні фармацевтичної композиції для лікування сексуальної дисфункції використовують дапоксетин або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-40 мкм, та використовують тадалафіл або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-60 мкм.

UA 80535 U

Корисна модель належить до фармацевтики, а саме, до лікарських препаратів, призначених для лікування сексуальної дисфункції, зокрема для лікування передчасної еякуляції.

У медицині під поняттям "сексуальні дисфункції" розуміють стійкі і часті порушення сексуального функціонування організму людини під час статевого акту.

За схемою, запропонованою У. Мастере і В. Джонсон, сексуальні дисфункції у чоловіків поділяються на наступні види порушень сексуального функціонування організму людини:

- 1) первинна еректильна дисфункція;
- 2) вторинна еректильна дисфункція;
- 3) передчасна еякуляція;
- 4) затримана еякуляція.

Передчасна еякуляція, за результатами досліджень, є поширеним явищем, і певна частина чоловіків (від 17 до 31 % в залежності від віку) скаржаться на певні проблеми такого роду, які виникають як іноді (непостійно та неперіодично), так і постійно або періодично.

Передчасною еякуляцією називають занадто швидкий і неконтрольований наступ сім'явиверження, що настає відразу після введення члена в піхву або навіть до нього. Передчасна еякуляція є однією з найпоширеніших форм сексуальної дисфункції. У кожного чоловіка або пари передчасність цього процесу визначається індивідуально, але прийнято вважати, що еякуляція є передчасною, коли з моменту початку статевого акту до неї проходить менше однієї-двох хвилин.

Причини передчасної еякуляції можуть бути фізіологічними та психологічними. До фізіологічних причин належать:

- урологічні захворювання (такі як простатит, уретрит, орхоепідидиміт, везикуліт та інші);
- захворювання, що передаються статевим шляхом;
- патологічні процеси, що відбуваються в корі головного мозку;
- соматичні захворювання (наприклад, серцево-судинні, ендокринні, неврологічні, цукровий діабет);
- підвищена чутливість або гіперчутливість головки статевого члена. До психологічних причин можна віднести:

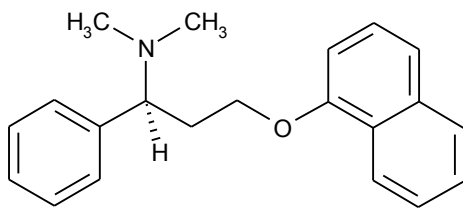
- незадоволеність сімейним життям;
- підліткова невпевненість чи страх бути захопленим під час статевого акту;
- боязнь інтимних відносин;
- відсутність взаєморозуміння з партнером;
- спогади про проблеми і невдачі, які спіткали на початку статевого життя;
- нервозність або занепокоєння під час ласк перед статевим актом.

Як відмічають фахівці, найбільш частішою причиною передчасної еякуляції є комбінація такого фізіологічного фактору як підвищена чутливість головки статевого члена і такого психологічного фактора як нервозність або занепокоєння під час ласк. Нервозність або занепокоєння часто викликається страхом швидкого сім'явиверження і нездатністю задовольнити сексуального партнера. Сукупність зазначених двох факторів у свою чергу призводить до перезбудження та втрати контролю над собою під час статевого акту. Один або декілька епізодів статевого акту із передчасною еякуляцією та переживання з цього приводу часто породжують своєрідне психологічне "замкнуте коло", яке призводить до повторної передчасної еякуляції.

Хоча така сексуальна дисфункція як передчасна еякуляція не загрожує життю, вона впливає на сексуальне здоров'я чоловіків, що відображається на їх психо-емоційному та загальному стані. Крім того, постійна або періодична передчасна еякуляція може призводити до сімейної дисгармонії в цілому.

Серед заходів, рекомендованих Європейською асоціацією урологів для етіотропної терапії передчасної еякуляції, є такий захід як використання сполук, що належать до класу селективних інгібіторів зворотного захоплення серотоніну (див. Colpi G., Weidner W., Jungwirth A et al. EAU Guidelines on ejaculatory dysfunction // Eur. Urol.-2004. - V.46. - P.555-558).

Дапоксетин - це сполука, що має за IUPAC назву (S)-(+)-N,N-диметил-3-(1-нафтален-1-ілокси)-1-фенілпропан-1-амін, її структурна формула



(I),

Дапоксетин належить до класу селективних інгібіторів зворотного захоплення серотоніну (аббревіатура англійською мовою SSRI). Він був синтезований при пошуку та дослідженнях антидепресантів, які поглинаються і повністю виводиться з організму за декілька годин. Його одержання описано, наприклад, у таких патентних документах як опис до патенту EP 0288188 B1. При дослідженнях дапоксетину та інших сполук класу SSRI була виявлена така властивість як вплив на еякуляцію - приймання сполук класу SSRI затримує момент настання еякуляції та відповідно збільшує час тривалості статевого акту. Сполуки класу SSRI діють вибірково, блокуючи рецептори в корі головного мозку, що взаємодіють із серотоніном, і таким чином збільшують час до настання еякуляції.

Фармацевтичні композиції на основі дапоксетину, які призначені для лікування передчасної еякуляції, та застосування цих фармацевтичних композицій для лікування передчасної еякуляції, описані у описі до патенту EP 1225881 B1 (опубл. 22.02.2006). Препарати, що містять фармацевтичну композицію на основі дапоксетину, можуть збільшувати тривалість статевого акту на декілька хвилин, вони послаблюють напругу та нервозність під час статевих стосунків, дозволяють чоловікові отримувати сексуальне задоволення та насолоджуватись статевим актом більш тривалий час.

Описані фармацевтичні композиції вживають за одну-три години до планованої сексуальної активності, також зазначається що вони також дають певний ефект при разовому вживанні та вживанні безпосередньо перед статевим актом. Але, як зазначається у документі та у літературі, найкращі результати досягаються при вживанні принаймні за одну-три години перед статевим актом, і для того, щоб вживання фармацевтичної композиції дало значний лікувальний ефект, її необхідно вживати принаймні за 30 хвилин перед статевим актом. Хоча у документі зазначається, що описані фармацевтичні композиції можна вживати безпосередньо перед статевим актом (тобто приблизно за одну хвилину або менше перед статевим актом), але, як показали дослідження, таке вживання не дає якого-небудь значного лікувального ефекту. Це пов'язано із тим, що фармацевтичні композиції, описані у патенті EP 1225881 B1, зазвичай застосовують у вигляді твердих дозованих форм (наприклад, у формі таблеток), які недостатньо швидко розпадаються у шлунково-кишковому тракті, та пов'язано із недостатньою швидкістю всмоктування дапоксетину.

В житті досить часто бувають ситуації, коли сексуальна активність не є планованою, і чоловік розуміє, що в нього буде статевий акт, лише за короткий час перед статевим актом. Під коротким часом у даному випадку розуміється час від 5 до 15 хвилин перед статевим актом. Вживання описаної фармацевтичної композиції за короткий час перед статевим актом теж не дає очікуваного значного лікувального ефекту. Це пов'язано із тим, що після прийому фармацевтичної композиції у вигляді твердої дозованої форми потрібний певний проміжок часу (який більше 10 хвилин), щоб описана фармацевтична композиція розпалася, дапоксетин потрапив у кров і почав впливати на організм людини.

В основу корисної моделі поставлена задача створення фармацевтичного препарату для лікування такої сексуальної дисфункції, як передчасна еякуляція, який забезпечував би потрібний лікувальний ефект при вживанні за короткий час перед статевим актом.

Ця задача вирішується створеною фармацевтичною композицією для лікування сексуальної дисфункції, яка містить дапоксетин або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір, тадалафіл або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір, двохосновний кальцію фосфат, та принаймні одну фармацевтично прийнятну допоміжну речовину, причому при виготовленні фармацевтичної композиції для лікування сексуальної дисфункції використовують дапоксетин або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-40 мкм, та використовують Тадалафіл або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-60 мкм, при наступному співвідношенні компонентів у мас. %:

дапоксетин або його
фармацевтично прийнятну сіль,
або його фармацевтично

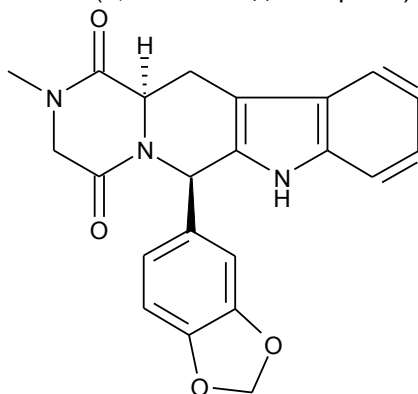
5-30

прийнятний ефір
тадалафіл або його
фармацевтично прийнятну сіль,
або його фармацевтично
прийнятний ефір 15-70
двохосновний кальцію фосфат 15-40
принаймні одна фармацевтично
прийнятна допоміжна речовина 1-65.

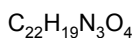
Крім того, фармацевтична композиція для лікування сексуальної дисфункції може містити як фармацевтично прийнятну допоміжну речовину із ряду розпушувач, розріджувач, зв'язуюче, зм'ягчувальний агент, речовина, що сприяє проковзуванню.

Крім того, фармацевтична композиція для лікування сексуальної дисфункції може бути виконана у формі таблетки.

Тадалафіл - це сполука, яка має за IUPAC назву (6R, 12aR)-2,3,6,7,12,12a-гексагідро-2-метил-6-(3,4-метилендіоксифеніл)-піразино[2',1':6,1]піридо[3,4-b]індол-1,4-діон;



Tadalafil



Тадалафіл був синтезований при дослідженні сполук, які можна застосовувати для поліпшення кровотоку та лікуванні стенокардії і ішемічної хвороби серця. У ході клінічних випробувань сполуки було виявлено несподіваний ефект - сполука має найбільш виражений вплив на кровотік в області органів малого таза, зокрема у статевому члені.

Тадалафіл є селективним інгібітором циклічного гуанозину монофосфату (скорочено називають цГМФ) - специфічної фосфодіестерази 5 типу (скорочено називають ФДЕ5), яка відповідає за розпад цГМФ в кавернозному тілі статевого члена. Фізіологічний механізм ерекції статевого члена передбачає вивільнення оксиду азоту (NO) в кавернозному тілі при сексуальній стимуляції. NO активує фермент гуанілатциклазу, що підвищує рівень цГМФ, розслабляє гладенькі м'язи кавернозного тіла і підсилює кровотік у статевому члені. Тадалафіл прямо не впливає на кавернозне тіло, але активно посилює розслаблюючий ефект NO на цю тканину - під впливом тадалафілу збільшується кількість крові, яка надходить в статевий член при сексуальному збудженні чоловіка. Дослідження *in vitro* показали, що активність тадалафілу щодо ФДЕ5 в 10-10000 раз перевищує його активність щодо інших ізоформ фосфодіестерази (ФДЕ 1, 2, 3, 4 і 6). Зокрема активність тадалафілу щодо ФДЕ5 в 4 000 раз перевищує його активність щодо ФДЕ3 - цАМФ-специфічної фосфодіестерази, що бере участь в скороченні серця.

Тадалафіл діє тільки тоді, коли чоловік відчуває природне сексуальне збудження, а коли статевий акт закінчений, статевий член природним чином повертається в розслаблений стан. Тобто тадалафіл діє тільки на природні механізми виникнення ерекції, і може досить ефективно використовуватись для лікування еректильної дисфункції у чоловіків, у яких з певних причин поступає мало крові у статевий член.

Потрібно вказати, що при застосуванні тадалафілу в деяких випадках існує загроза передчасної еякуляції і відповідно зменшення часу тривалості статевого акту. Це пояснюється тим, що після вживання чоловіком тадалафілу статевий член у збудженому стані може мати значно більші розміри у порівнянні із розміром статевого члена при звичайній ерекції, що може призвести до підвищеної чутливості або гіперчутливості головки статевого члена. Підвищена чутливість або гіперчутливість головки статевого члена є причиною передчасної еякуляції.

Дослідження показали, що поєднання таких активних речовин як тадалафіл та дапоксетин в одній фармацевтичній композиції, сприяє більш швидкому всмоктуванню дапоксетину та більш

сильному його впливу на організм людини. Тадалафіл всмоктується швидше за дапоксетин, і підвищує кровотік у організмі людини (прикладом цього є одна із побічних дій при прийомі тадалафілу - у певній кількості чоловіків спостерігається приплив крові до обличчя внаслідок підвищення кровотоку в організмі). Підвищення кровотоку в організмі людини у свою чергу сприяє настанню потрібного для лікувального ефекту рівня дапоксетину у крові за менший проміжок часу та більш сильному впливу дапоксетину на організм людини.

Застосування для виготовлення заявленої фармацевтичної композиції дапоксетину (або його фармацевтично прийнятної солі або його фармацевтично прийнятного ефіру) у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-40 мкм теж сприяє більш швидкому всмоктуванню дапоксетину та настанню потрібного рівня дапоксетину у крові за менший проміжок часу. Найбільш оптимальним є застосування дапоксетину (або його фармацевтично прийнятної солі, або його фармацевтично прийнятного ефіру) у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-10 мкм. Застосування дапоксетину у порошкоподібній формі із розміром частинок більше 40 мкм не дає значного ефекту на швидкість всмоктування дапоксетину, застосування дапоксетину у порошкоподібній формі із розміром частинок менше 1 мкм недоцільно, так як отримання порошку із розміром частинок менше 1 мкм вимагає більш значних витрат у порівнянні із отриманням порошку із розміром частинок 1-40 мкм.

Застосування для виготовлення заявленої фармацевтичної композиції тадалафілу (або його фармацевтично прийнятної солі, або його фармацевтично прийнятного ефіру) у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-60 мкм сприяє більш швидкому всмоктуванню тадалафілу та настанню більш високого рівня тадалафілу у крові за невеликий проміжок часу. Найбільш оптимальним є застосування тадалафілу (або його фармацевтично прийнятної солі, або його фармацевтично прийнятного ефіру) у порошкоподібній формі із розміром частинок 10-60 мкм. Застосування тадалафілу у порошкоподібній формі із розміром частинок більше 60 мкм не дає значного ефекту на швидкість всмоктування Тадалафілу, застосування силденфілу у порошкоподібній формі із розміром частинок менше 1 мкм недоцільно, так як отримання порошку із розміром частинок менше 1 мкм вимагає більш значних витрат у порівнянні із отриманням порошку із розміром частинок 1-60 мкм.

Двохосновний кальцію фосфат є сполукою, яку застосовують у фармакології для прискорення розчинення фармацевтичних препаратів, що використовують у вигляді твердої дозованої форми (наприклад, у формі таблеток). Застосування двохосновного кальцію фосфату у фармацевтичній композиції призводить до швидкого розпаду заявленої фармацевтичної композиції протягом часу до однієї хвилини, що відповідно сприяє більш швидкому всмоктуванню тадалафілу і дапоксетину, та зменшенню часу від моменту вживання фармацевтичної композиції до моменту потрапляння у кров тадалафілу і дапоксетину.

Заявлені у формулі корисної моделі межі співвідношення компонентів у складі заявленої фармацевтичної композиції є оптимальними, так як менші або більші кількості дапоксетину, тадалафілу та двохосновного кальцію фосфату призводять до зменшення лікувального ефекту або до збільшення часу між моментом вживання заявленої фармацевтичної композиції та моментом настання потрібного лікувального ефекту.

Більш швидкий розпад твердої дозованої форми та більш швидке всмоктування дапоксетину призводить до зменшення часу від моменту вживання лікарського засобу до моменту для настання лікувального ефекту. Сукупність таких ознак у заявленій фармацевтичній композиції як наявність тадалафілу або його фармацевтично прийнятної солі, або його фармацевтично прийнятного ефіру, використання при виготовленні фармацевтичній композиції дапоксетину або його фармацевтично прийнятої солі, або його фармацевтично прийнятного ефіру у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-40 мкм та тадалафілу або його фармацевтично прийнятної солі, або його фармацевтично прийнятного ефіру у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-60 мкм, наявність двохосновного кальцію фосфату призводить до зменшення часу, потрібного від моменту вживання фармацевтичної композиції до моменту настання значного лікувального ефекту, та можливості вживати фармацевтичні композиції на основі дапоксетину для лікування передчасної еякуляції у випадку необхідності вживання за короткий час перед статевим актом.

Крім того, тадалафіл сприяє підсиленню ерекції статевого члена при статевому акті, що разом із збільшенням часу тривалості статевого акту може призводити до додаткового підвищення сексуального задоволення учасників статевого акту.

Заявлена фармацевтична композиція може бути виконана у твердій дозованій формі, наприклад, у такій препаративній формі як таблетки, гранули тощо. Переважною формою виконання заявленої фармацевтичної композиції є таблетки.

Заявлена фармацевтична композиція може містити принаймні одну фармацевтично прийнятну допоміжну речовину, вибрану з ряду таких речовин як розпушувачі, розріджувачі, зв'язуюче, змащувальні агенти, речовини, що сприяють проковзуванню.

5 Фармацевтична композиція, яка має тверду дозовану форму, наприклад, таку як таблетки або гранули, потребує розпушувача, який сприяє зменшенню зв'язків між частинками та більш швидкому розпаду фармацевтичної композиції. Як розпушувач можуть використовуватись будь-які речовини, що описані у патентних та непатентних документах, наприклад, такі речовини як натрію кроскармелоза (наприклад, марки Solutab), поліакрилат калію, кросповідон (наприклад, марки KOLLIDON, марки POLYPLASDONE), полівінілпіролідон, натрію гліколят крохмалю (наприклад, марки PRIMOGEL, EXPLOTAB), гідроксипропілметилцелюлоза, гідроксипропілцелюлоза, кальцію целюлоза, крохмаль, наприклад, кукурудзяний, картопляний, желетинізований та модифікований крохмаль, глина, бентоніт, мікрокристалічна целюлоза (наприклад, марки Avicel), іоніти (наприклад, марки Amberlite), альгінати, природні полімери, такі як агар, гуар, смола ріжкового дерева, камедь карайї, пектин, трагакантова камедь, або суміші вказаних речовин.

15 Як розріджувач у фармацевтичній композиції можуть бути використані, наприклад, такі речовини як тальк, лактоза, сахароза, крохмаль, модифікований крохмаль, манітол, сорбітол, неорганічні солі, похідні целюлози (наприклад, мікрокристалічна целюлоза), сульфат кальцію, ксилітол, лактитол, желетинізований крохмаль, каолін, цукроза, декстран, декстрин, мальтодекстрин, декстро́за, карбонат кальцію, дво́хосновний кальцію фосфат, трьохосновний кальцію фосфат, карбонат магнію, оксид магнію, а також суміші вказаних речовин.

20 Як зв'язуюче у заявленій фармацевтичній композиції можуть бути використані, наприклад, такі речовини як лактоза, крохмаль, зокрема кукурудзяний, картопляний, модифікований крохмаль, цукри, гуар, пектин, воски, мікрокристалічна целюлоза, метилцелюлоза, карбоксиметилцелюлоза, гідроксипропілметилцелюлоза, гідроксіетил целюлоза, гідроксипропілцелюлоза, співполівідон, альгінат натрію, камедь, альгінова кислота, трагакантова камедь, натрію карбоксиметилцелюлоза, етилцелюлоза, желатин, рідка глюкоза, повідон, желетинізований крохмаль, а також суміші вказаних речовин.

30 Змащувальний агент забезпечує вільне переміщення порошкоподібних компонентів заявленої фармацевтичної композиції при їх змішуванні та виготовленні такої препаративної форми як таблетки. Як змащувальний агент можуть бути використані, наприклад, такі речовини як стеарат кальцію, стеарат магнію, натрію стеарилфумарат, стеарат цинку, мінеральні масла, стеаринова кислота, фумарола кислота, пальмітинова кислота, тальк, карнаубський віск, гідрогенат рослинних олій, поліетиленгліколь, а також суміші вказаних речовин.

35 Зазначені вище фармацевтично прийнятні допоміжні речовини не обмежують можливості використання у заявленій фармацевтичній композиції інших видів фармацевтично прийнятних допоміжних речовин.

Заявлену фармацевтичну композицію можна одержати відомими для фахівців способами, наприклад змішуванням потрібної кількості активних речовин, дво́хосновного кальцію фосфату та принаймні однієї фармацевтично прийнятною допоміжною речовини. Змішування відібраних частинок проводять в пристроях, які зазвичай використовуються у фармацевтичній промисловості, до одержання гомогенної суміші заявленої фармацевтичної композиції. З отриманої гомогенної суміші заявленої фармацевтичної композиції виготовляють її препаративні форми, наприклад, гранули, таблетки тощо. Гранули можуть бути виготовлені будь-яким відомим фахівцю способом, наприклад, способом сухого гранулювання. Таблетки можуть бути виготовлені будь-яким відомим фахівцю способом пресування. На таблетки після їх виготовлення може бути нанесено покриття.

40 Як перший активний компонент заявленої фармацевтичної композиції може бути використаний дапоксетин або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір будь-якого ступеня чистоти. Як фармацевтично прийнятну сіль дапоксетину або його фармацевтично прийнятний ефір можуть бути використані сполуки, описані у патентних та непатентних документах, наприклад, описані у описі до патента EP 1225881 B1. Як приклад може бути використана така сіль дапоксетину як дапоксетин гідрохлориду. При виготовленні заявленої фармацевтичної композиції використовують порошкоподібний дапоксетин або його фармацевтично прийнятна сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір, який містить частинки, що можуть мати розмір від 1 до 40 мкм. Зрозуміло, що важко чітко обмежити розмір частинок, які є у порошку тільки зазначеною нижньою чи верхньою границею, тому у даному випадку розуміється, що під розмір частинок від 1 до 40 мкм підпадають порошки, які мають параметр розміру частинок D90 40 мкм.

як другий активний компонент заявленої фармацевтичної композиції може бути використаний тадалафіл або його фармацевтично прийнятна сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір будь-якого ступеня чистоти. Як фармацевтично прийнятну сіль тадалафілу або його фармацевтично прийнятний ефір можуть бути використані сполуки, описані у патентних та непатентних документах, наприклад, описані у описі до патенту US 5250534. Як приклад може бути використана така сіль тадалафілу як тадалафіл цитрату. При виготовленні заявленої фармацевтичної композиції використовують порошкоподібний тадалафіл або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір, який містить частинки, що можуть мати розмір від 1 до 60 мкм. Зрозуміло, що важко чітко обмежити розмір частинок, які є у порошку тільки зазначеною нижньою чи верхньою границею, тому у даному випадку розуміється, що під розмір частинок від 1 до 60 мкм підпадають порошки, які мають параметр розміру частинок D90 60 мкм.

Далі показані приклади можливих варіантів складу заявленої фармацевтичної композиції.

Приклад 1

Для виготовлення фармацевтичної композиції у формі таблетки масою 300 мг використовують 35 мг дапоксетин гідрохлориду, 70 мг тадалафіл цитрату, 70 мг двохосновного кальцію фосфату, 90 мг мікрокристалічної целюлози, 20 мг натрію кроскармелози, 15 мг стеарат магнію.

Приклад 2

Для виготовлення фармацевтичної композиції у формі таблетки масою 300 мг використовують 25 мг дапоксетин гідрохлориду, 60 мг тадалафіл цитрату, 80 мг двохосновного кальцію фосфату, 100 мг мікрокристалічної целюлози, 20 мг натрію кроскармелози, 15 мг стеарат магнію.

Приклад 3

Для виготовлення фармацевтичної композиції у формі таблетки масою 300 мг використовують 55 мг дапоксетин гідрохлориду, 50 мг тадалафіл цитрату, 50 мг двохосновного кальцію фосфату, 100 мг мікрокристалічної целюлози, 30 мг натрію кроскармелози, 25 мг стеарат магнію.

Приклад 4

Для виготовлення фармацевтичної композиції у формі таблетки масою 300 мг використовують 80 мг дапоксетин гідрохлориду, 100 мг тадалафіл цитрату, 50 мг двохосновного кальцію фосфату, 50 мг мікрокристалічної целюлози, 15 мг натрію кроскармелози, 5 мг стеарат магнію.

Приклад 5

Для виготовлення фармацевтичної композиції у формі таблетки масою 300 мг використовують 18 мг дапоксетин гідрохлориду, 50 мг тадалафіл цитрату, 90 мг двохосновного кальцію фосфату, 112 мг мікрокристалічної целюлози, 20 мг натрію кроскармелози, 10 мг стеарат магнію.

Дослідження заявленої фармацевтичної композиції на 150 пацієнтах показало, що для пацієнтів, які приймали заявлену фармацевтичну композицію із дозою дапоксетину у 40 мг за 5 хвилин до статевому акту середнє збільшення часу тривалості статевому акту становило 2,2 хвилини. Для пацієнтів, які приймали заявлену фармацевтичну композицію із дозою дапоксетину у 40 мг за 10 хвилин до статевому акту середнє збільшення часу тривалості статевому акту становило 3,5 хвилини. Для пацієнтів, які приймали заявлену фармацевтичну композицію із дозою дапоксетину у 40 мг за 15 хвилин до статевому акту, середнє збільшення часу тривалості статевому акту становило 4,3 хвилини.

У порівнянні, для пацієнтів, які приймали описану у описі до патенту EP 1225881 B1 фармацевтичну композицію із дозою дапоксетину у 40 мг за 5 хвилин до статевому акту, середнє збільшення часу тривалості статевому акту становило 0,9 хвилини. Для пацієнтів, які приймали фармацевтичну композицію із дозою дапоксетину у 40 мг за 10 хвилин до статевому акту, середнє збільшення часу тривалості статевому акту становило 1,5 хвилини. Для пацієнтів, які приймали фармацевтичну композицію із дозою дапоксетину у 40 мг за 15 хвилин до статевому акту, середнє збільшення часу тривалості статевому акту становило 2,5 хвилини.

Описані прикладі лише ілюструють можливі варіанти виконання корисної моделі, але не обмежують її.

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

1. Фармацевтична композиція для лікування сексуальної дисфункції, яка містить дапоксетин або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір та принаймні одну фармацевтично прийнятну допоміжну речовину, яка **відрізняється** тим, що додатково містить тадалафіл або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір, додатково містить двохосновний кальцію фосфат, причому при виготовленні фармацевтичної композиції для лікування сексуальної дисфункції використовують дапоксетин або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-40 мкм, та використовують тадалафіл або його фармацевтично прийнятну сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір у порошкоподібній формі із розміром частинок 1-60 мкм, при наступному співвідношенні компонентів у мас. %:
дапоксетин або його фармацевтично прийнятна сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір 5-30
тадалафіл або його фармацевтично прийнятна сіль, або його фармацевтично прийнятний ефір 15-70
двохосновний кальцію фосфат 15-40
принаймні одна фармацевтично прийнятна допоміжна речовина 1-65.
2. Фармацевтична композиція для лікування сексуальної дисфункції за п. 1, яка **відрізняється** тим, що містить фармацевтично прийнятну допоміжну речовину із ряду розпушувач, розріджувач, зв'язуюче, змащувальний агент, речовина, що сприяє проковзуванню.
3. Фармацевтична композиція для лікування сексуальної дисфункції за п. 1, п. 2, яка **відрізняється** тим, що виконана у формі таблетки.

Комп'ютерна верстка С. Чулій

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Урицького, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут промислової власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601