



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ(21)(22) Заявка: **2012104639/15**, 07.07.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
10.07.2009 FR 0954819(43) Дата публикации заявки: **20.08.2013** Бюл. № 23(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: **10.02.2012**(86) Заявка РСТ:
FR 2010/051426 (07.07.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/004117 (13.01.2011)Адрес для переписки:
**109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент"**

(71) Заявитель(и):

**ПЕРОВИЧ Филипп (FR),
МОРИ Марк (FR),
ДЮМОНТЕИ Жан-Пьер (FR)**

(72) Автор(ы):

**ПЕРОВИЧ Филипп (FR),
МОРИ Марк (FR),
ДЮМОНТЕИ Жан-Пьер (FR)****(54) СПОСОБ И ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ПОСТПРАНДИАЛЬНОЙ
ГИПЕРГЛИКЕМИИ ДИАБЕТА II ТИПА ВВЕДЕНИЕМ ЧЕРЕЗ СЛИЗИСТУЮ РОТОВОЙ ПОЛОСТИ****(57) Формула изобретения**

1. Фармацевтическая композиция, характеризующаяся тем, что она имеет форму водно-спиртового раствора, в котором стабильно и полно растворено, по меньшей мере, одно гипогликемизирующее/инсулинотропное действующее вещество в дозировке, сниженной по меньшей мере на 30-50% по сравнению с обычной разовой дозой при пероральном введении, для его применения введением через слизистую ротовой полости в качестве лекарственного средства при точном лечении постпрандиальной гипергликемии диабета II типа у человека или у животного.

2. Фармацевтическая композиция по п.1, в которой крепость составляет, по меньшей мере, 30°.

3. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, которая осуществлена на базе воды и этанола.

4. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, в которой гипогликемизирующее действующее вещество присутствует в форме основания и/или в форме соли.

5. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, которая имеет форму водно-спиртового раствора объемом менее 2 мл, в котором стабильно и полно растворено количество, меньшее или равное 250 мг, по меньшей мере, одного гипогликемизирующего действующего вещества.

6. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, в которой гипогликемизирующее действующее вещество в дозировке, сниженной на 30-50% по сравнению с обычной

разовой дозой при пероральном введении, выбирают из числа липофильных или амфифильных действующих веществ, таких как гликлазид, метформин, глибенкламид, глиниды и инкретины.

7. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, которая дополнительно включает вещество, корректирующее рН.

8. Фармацевтическая композиция по п.7, в которой вещество, корректирующее рН, выбирают из числа карбонатов и бикарбонатов натрия, первичного и вторичного кислого фосфатов натрия, триэтаноламина, гидроокиси натрия, калия, и/или из кислот: соляной, серной, янтарной, масляной, фосфорной, лимонной, яблочной и/или молочной.

9. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, которая имеет рН в диапазоне от 4,5 до 9,0.

10. Фармацевтическая композиция по п.1 или 2, которая дополнительно содержит добавку, усиливающую растворение гипогликемизирующего действующего вещества в форме соединения на основе витамина Е.

11. Фармацевтическая композиция, характеризующаяся тем, что она имеет форму водно-спиртового раствора, в котором стабильно и полно растворено, по меньшей мере, одно гипогликемизирующее/инсулиноотропное действующее вещество в дозировке, сниженной, по меньшей мере, на 30-50% по сравнению с обычной разовой дозой при пероральном введении, для его применения введением через слизистую ротовой полости в качестве лекарственного средства при точном лечении постпрандиальной гипергликемии диабета II типа у человека или у животного, чтобы без промедления вызвать стимуляцию выработки инсулина поджелудочной железой, близкой к необходимой физиологической секреции.

12. Фармацевтическая композиция по п.11, в которой крепость составляет, по меньшей мере, 30°.

13. Фармацевтическая композиция по п.11 или 12, которая осуществлена на базе воды и этанола.

14. Фармацевтическая композиция по п.11 или 12, в которой гипогликемизирующее действующее вещество присутствует в форме основания и/или в форме соли.

15. Фармацевтическая композиция по п.11 или 12, которая имеет форму водно-спиртового раствора объемом менее 2 мл, в котором стабильно и полно растворено количество, меньшее или равное 250 мг, по меньшей мере, одного гипогликемизирующего действующего вещества.

16. Фармацевтическая композиция по п.11 или 12, в которой гипогликемизирующее действующее вещество в дозировке, сниженной на 30-50% по сравнению с обычной разовой дозой при пероральном введении, выбирают из числа липофильных или амфифильных действующих веществ, таких как гликлазид, метформин, глибенкламид, глиниды и инкретины.

17. Фармацевтическая композиция по п.11 или 12, которая дополнительно включает вещество, корректирующее рН.

18. Фармацевтическая композиция по п.17, в которой вещество, корректирующее рН, выбирают из числа карбонатов и бикарбонатов натрия, первичного и вторичного кислого фосфатов натрия, триэтаноламина, гидроокиси натрия, калия, и/или из кислот: соляной, серной, янтарной, масляной, фосфорной, лимонной, яблочной и/или молочной.

19. Фармацевтическая композиция по п.11 или 12, которая имеет рН в диапазоне от 4,5 до 9,0.

20. Фармацевтическая композиция по п.11 или 12, которая дополнительно содержит добавку, усиливающую растворение гипогликемизирующего действующего вещества в форме соединения на основе витамина Е.

21. Способ приготовления фармацевтической композиции по любому из пп.1-20,

характеризующийся тем, что он включает следующие этапы:

- смешивание спирта и очищенной воды и введение в эту смесь, по меньшей мере, одного гипогликемизирующего/инсулинотропного действующего вещества,
- перемешивание препарата до полного растворения действующего вещества, и
- фильтрация полученного раствора через фильтр пористостью 0,45 мкм.

22. Способ по п.21, включающий следующие этапы:

- смешивание этанола и очищенной воды и введение в эту смесь метформина, гликлазида, глибенкламида, репаглинида, ситаглиптина или вильдаглиптина или саксаглиптина,
- перемешивание препарата в течение 10-60 мин до получения однородной суспензии и полного растворения действующего вещества, и
- фильтрация полученного раствора через фильтр пористостью 0,45 мкм.

23. Способ по п.21 или 22, дополнительно включающий следующие этапы перед фильтрацией:

- введение растворяющей добавки, и/или
- постепенное введение вещества, корректирующего pH, до достижения желаемого pH в диапазоне от 4,5 до 8,0,
- продолжение перемешивания предпочтительно в течение 5-30 минут до полного растворения действующего вещества.

24. Применение фармацевтической композиции, полученной способом по любому из пп.21-23, для получения лекарственного средства для введения через слизистую ротовой полости, предназначенного для точного лечения постпрандиальной гипергликемии диабета II типа у человека или у животного.

25. Применение по п.24 для получения лекарственного средства для введения через слизистую ротовой полости, предназначенного для точного лечения постпрандиальной гипергликемии диабета II типа у человека или у животного, стимуляцией выработки без промедления инсулина поджелудочной железой, близкой к необходимой физиологической секреции.