



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2017131709, 27.10.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

10.12.2009 EP 09178762.2;

27.10.2009 US 61/255,241

(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,
из которой данная заявка выделена:

2012121708 25.05.2012

(43) Дата публикации заявки: 06.02.2019 Бюл. №
04

Адрес для переписки:

109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО

"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

**БЕЗЕН ХЕЛТКЭАР ЛЮКСЕМБУРГ
САРЛ (LU)**

(72) Автор(ы):

**МАЗИНИ-ЭТЕВ, Валери (FR),
КАНЭ, Дени (BE)**(54) **ТРАНСДЕРМАЛЬНЫЕ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ, СОДЕРЖАЩИЕ АКТИВНЫЕ АГЕНТЫ**

(57) Формула изобретения

1. Фармацевтическая композиция замедленного высвобождения для местного применения на поверхность кожи, содержащая:

- фармацевтически активный агент, включающий один или несколько стероидов,
- от 0,01% до 5% по массе от общей массы фармацевтической композиции эфира жирной кислоты,

- воду,

- C2-C6 моноспирт,

- жирную кислоту, и

- от 0,05% до 5% по массе гелеобразующего вещества,

где отношение массы эфира жирной кислоты в композиции ко всему активному агенту в указанной композиции составляет, по меньшей мере, 4:1, эфир отношение жирной кислоты: активный агент, предпочтительно от 4:1 до 20:1.

2. Композиция по п. 1, которая дополнительно содержит соразтворитель, предпочтительно пропиленгликоль.

3. Композиция по п. 2, в которой соразтворитель присутствует в количестве от 0,01% до 7% по массе от общей массы фармацевтической композиции, предпочтительно от 3% до 7% по массе.

4. Композиция по п. 1, в которой эфир жирной кислоты выбирают из группы, состоящей из этилолеата, изопропилолеата, изопропилмиристата, изопропилизостеарата, изопропилпальмитата, этилоктаноата, этилдодеканоата, этиллинолеата, этилпальмитолеата, этилизостеарата и этиллинолената.

5. Композиция по п. 1, в которой эфир жирной кислоты представляет собой изопропилмирикат.

6. Композиция по п. 1, в которой эфир жирной кислоты представляет собой этилолеат.

7. Композиция по п. 1, в которой эфир жирной кислоты представляет собой эфир, который может образоваться при взаимодействии жирной кислоты, входящей в состав композиции, со спиртом.

8. Композиция по п. 1, в которой эфир жирной кислоты не является эфиром, который может образоваться при взаимодействии жирной кислоты, входящей в состав композиции, со спиртом, находящимся в композиции.

9. Композиция по п. 1, в которой эфир жирной кислоты присутствует в количестве от 0,05% до 2,4% по массе, от общей массы фармацевтической композиции, предпочтительно от 0,1% до 2,2% по массе.

10. Композиция по п. 1, в которой жирная кислота является C8-C22 жирной кислотой, которую предпочтительно выбирают из группы, состоящей из каприновой кислоты, лауриновой кислоты, миристиновой кислоты, пальмитиновой кислоты, стеариновой кислоты, олеиновой кислоты, изостеариновой кислоты, пальмитолеиновой кислоты, линолеиновой кислоты и линоленовой кислоты, и более предпочтительно жирная кислота представляет собой олеиновую кислоту.

11. Композиция по п. 1, в которой жирная кислота присутствует в количестве от 0,01% до 5% по массе от общей массы фармацевтической композиции, предпочтительно от 0,05% до 3,5% по массе, и более предпочтительно от 1,0% до 3,0% по массе.

12. Композиция по п. 1, содержащая 2% этилолеата в качестве эфира жирной кислоты, 2% олеиновой кислоты в качестве жирной кислоты, и 5% пропиленгликоля в качестве соразтворителя, все по массе от общей массы фармацевтической композиции.

13. Композиция по п. 1, содержащая 0,3% этилолеата в качестве эфира жирной кислоты, 0,3% олеиновой кислот в качестве жирной кислоты, и 0,75% пропиленгликоля в качестве соразтворителя, все по массе от общей массы фармацевтической композиции.

14. Композиция по п. 1, в которой фармацевтически активный агент содержит один или несколько стероидов, которые выбирают из группы, состоящей из эстрогенов, анти-эстрогенов, андрогенов, анти-андрогенов и прогестинов.

15. Композиция по п. 1, в которой фармацевтически активный агент выбирают из одного или нескольких из эстрадиола и прогестерона, и эфир жирной кислоты представляет собой этилолеат.

16. Композиция по п. 1, в которой фармацевтически активный агент выбирают из одного или нескольких из тестостерона и дигидротестостерона (DHT), и эфир жирной кислоты выбирают из этилолеата и изопропилмириката.

17. Композиция по п. 1, в которой активный агент присутствует в количестве от 0,01% до 5% по массе, от общей массы фармацевтической композиции.

18. Композиция по п. 1, в которой C2-C6 моноспирт выбирают из группы, состоящей из этанола, н-пропанола, изопропанола, н-бутанола, изобутанола, трет-бутанола, и их смесей, предпочтительно C2-C6 моноспирт является этанолом.

19. Композиция по п. 1, в которой C2-C6 моноспирт присутствует в количестве от 10% до 90% по массе, от общей массы фармацевтической композиции, предпочтительно от 20% до 80% по массе, и более предпочтительно от 45% до 75% по массе.

20. Способ обеспечения замедленного высвобождения фармацевтически активного агента через кожу субъекта, который включает поверхностное применение на кожу субъекта фармацевтической композиции, содержащей:

- фармацевтически активный агент, включающий один или несколько стероидов,
- от 0,1% до 20% по массе, от общей массы фармацевтической композиции, эфира жирной кислоты,

- воду,
- С2-С6 моноспирт,
- жирную кислоту; и
- от 0,05% до 5% по массе гелеобразующего вещества,

где отношение массы эфира жирной кислоты в композиции ко всему активному агенту в указанной композиции составляет, по меньшей мере, 4:1, отношение эфир жирной кислоты/активный агент, предпочтительно от 4:1 до 20:1.

21. Способ по п. 20, в котором применяется композиция по любому из пп. 2 - 19.

22. Способ по п. 20 или 21, в котором замедленное высвобождение фармацевтически активного агента через кожу наблюдается, по меньшей мере, 24 часа после указанного применения, предпочтительно, по меньшей мере, 36 часа после указанного применения, и более предпочтительно по меньшей мере, 48 часа после указанного применения.

RU 2017131102 A

RU 2017131709 A