РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

(19) **RU** (11) **2022 103 366** (13) **A**

(51) МПК
A61K 31/33 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: **2022103366, 26.06.2017**

Приоритет(ы):
(30) Конвенционный приоритет:
24.06.2016 US 62/354,465;
09.11.2016 US 62/419,736
(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки, из которой данная заявка выделена:
2019101810 23.01.2019

(43) Дата публикации заявки: **01.03.2022** Бюл. № **7**

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, строение 3, ООО "Юридическая фирма Городисский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):
ОПИАНТ ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ИНК. (US),
ЭДЖИС ТЕРАПЬЮТИКС, ЭлЭлСи (US)

(72) Автор(ы):
КРИСТАЛ, Роджер (US),
АГРАВАЛ, Арвинд (US),
МАДЖО, Эдвард Т. (US)

(54) СОСТАВЫ, УСТРОЙСТВА И СПОСОБЫ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ АЛКОГОЛЬНОЙ ЗАВИСИМОСТИ

(57) Формула изобретения

1. Способ лечения у субъекта алкогольной зависимости, включающий введение субъекту интраназальной композиции, содержащей терапевтически эффективное количество налтрексона или его фармацевтически приемлемой соли.

2. Способ по п. 1, отличающийся тем, что интраназальную композицию, содержащую налтрексон, вводят до употребления алкоголя.

3. Способ по п. 1, отличающийся тем, что интраназальную композицию, содержащую налтрексон, вводят примерно за 1-2 часа до употребления алкоголя.

4. Способ по п. 1, отличающийся тем, что интраназальную композицию, содержащую налтрексон, вводят примерно за 0,5-1 час до употребления алкоголя.

5. Способ по п. 1, отличающийся тем, что интраназальную композицию, содержащую налтрексон, вводят примерно за 10-30 минут до употребления алкоголя.

6. Способ по п. 1, отличающийся тем, что интраназальную композицию, содержащую налтрексон, вводят примерно за 5-10 минут до употребления алкоголя.

7. Способ по п. 1, отличающийся тем, что интраназальную композицию, содержащую налтрексон, вводят во время употребления алкоголя.

8. Способ по п. 1, отличающийся тем, что интраназальную композицию, содержащую налтрексон, вводят в течение 0,5 часа после начала употребления алкоголя.

9. Способ по п. 1, отличающийся тем, что интраназальная композиция содержит водный раствор.

10. Способ по любому из пп. 1-9, отличающийся тем, что каждая доза композиции содержит от около 2 до около 12 мг налтрексона или его соли или гидрата.

11. Способ по п. 10, отличающийся тем, что каждая доза композиции содержит от

RU 2022103366 A

RU 2022103366 A

около 2 до около 8 мг налтрексона или его соли или гидрата.

12. Способ по п. 11, отличающийся тем, что каждая доза композиции содержит около 4 мг налтрексона или его соли или гидрата.

13. Способ по любому из пп. 1-12, отличающийся тем, что субъекту вводят от около 0,05 до около 0,2 мл указанной композиции.

14. Способ по п. 13, отличающийся тем, что субъекту вводят около 0,1 мл указанной композиции.

15. Способ по п. 13, отличающийся тем, что указанная композиция находится в концентрации 40 мг/мл.

16. Способ по любому из пп. 1-15, отличающийся тем, что интраназальную композицию вводят в виде однократного введения в одно носовое отверстие.

17. Способ по любому из пп. 1-15, отличающийся тем, что интраназальную композицию вводят в виде двух введений, по одному в каждое носовое отверстие.

18. Способ по любому из пп. 1-17, отличающийся тем, что интраназальная композиция дополнительно содержит усилитель абсорбции.

19. Способ по п. 18, отличающийся тем, что усилитель абсорбции выбран из группы, состоящей из бензалкония хлорида, хитозанов, циклодекстринов, дезоксихолевой кислоты, додецил мальтозида, гликохолевой кислоты, лаурета-9, таурохолевой кислоты и тауродигидрофузидовой кислоты.

20. Способ по п. 18, отличающийся тем, что усилитель абсорбции представляет собой алкилсахарид.

21. Способ по п. 20, отличающийся тем, что алкилсахарид выбран из додецил мальтозида, тетрадецил мальтозида (TDM) и додеканоата сахарозы.

22. Способ по п. 21, отличающийся тем, что алкилсахарид представляет собой Intravail® (додецил мальтозид).

23. Способ по п. 22, отличающийся тем, что интраназальная композиция содержит в диапазоне от около 0,05% до около 2,5% Intravail® (додецил мальтозид).

24. Способ по п. 23, отличающийся тем, что интраназальная композиция содержит в диапазоне от около 0,1% до около 0,5% Intravail® (додецил мальтозид).

25. Способ по п. 24, отличающийся тем, что интраназальная композиция содержит около 0,25% Intravail® (додецил мальтозида).

26. Способ по п. 18, отличающийся тем, что усилитель абсорбции представляет собой бензалкония хлорид.

27. Способ по п. 26, отличающийся тем, что интраназальная композиция содержит от около 0,005% до около 0,015% бензалкония хлорида.

28. Способ по п. 27, отличающийся тем, что интраназальная композиция содержит около 0,01% бензалкония хлорида.

29. Способ по любому из пп. 1-28, отличающийся тем, что интраназальная композиция дополнительно содержит один или несколько вспомогательных веществ, выбранных из натрия хлорида, бензалкония хлорида, динатрия эдетата и кислоты.

30. Способ по п. 29, отличающийся тем, что кислоты достаточно для достижения pH 3,5-5,5.

31. Способ по любому из пп. 1-30, отличающийся тем, что терапевтически эффективное количество содержит от около 4 мг до около 16 мг налтрексона в день.

32. Способ по п. 31, отличающийся тем, что терапевтически эффективное количество налтрексона вводят в дозах около 4 мг в течение дня в соответствии с потребностями субъекта.

33. Способ по п. 32, отличающийся тем, что терапевтически эффективное количество налтрексона вводят в виде первой дозы около 4 мг утром и последующих доз около 4

RU 2022103366 A

RU 2022103366 A

мг по мере необходимости до употребления алкоголя.

34. Способ по любому из пп. 1-33, отличающийся тем, что терапевтически эффективное количество содержит от около 4 мг до около 16 мг налтрексона в день.

35. Способ по любому из пп. 1-33, отличающийся тем, что терапевтически эффективное количество налтрексона вводят в дозах 4 мг в течение дня в зависимости от потребности субъекта.

36. Способ по любому из пп. 1-33, отличающийся тем, что терапевтически эффективное количество налтрексона вводят в виде первой дозы 4 мг утром и последующих доз по 4 мг по мере необходимости до воздействия вещества или поведения, вызывающего зависимость.

37. Фармацевтическая композиция для интраназального введения, приготовленная в виде водного раствора, содержащая количество налтрексона или его фармацевтически приемлемой соли терапевтически эффективное для лечения алкогольной зависимости.

38. Фармацевтическая композиция по п. 37, содержащая от около 2,5 до около 12 мг налтрексона или его соли или гидрата.

39. Фармацевтическая композиция по п. 37, содержащая от около 2,5 до около 8 мг налтрексона или его соли или гидрата.

40. Фармацевтическая композиция по п. 39, содержащая около 4 мг налтрексона или его соли или гидрата.

41. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 37-40, отличающаяся тем, что субъекту доставляется от около 0,05 до около 0,2 мл указанной композиции.

42. Фармацевтическая композиция по п. 41, отличающаяся тем, что субъекту доставляется около 0,1 мл указанной композиции.

43. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 37-42, отличающаяся тем, что интраназальная композиция дополнительно содержит усилитель абсорбции.

44. Фармацевтическая композиция по п. 43, отличающаяся тем, что усилитель абсорбции выбран из группы, состоящей из бензалкония хлорида, хитозанов, циклодекстринов, дезоксихолевой кислоты, додецил мальтозида, гликохолевой кислоты, лаурета-9, таурохолевой кислоты и тауродигидрофузидовой кислоты.

45. Фармацевтическая композиция по п. 43, отличающаяся тем, что усилитель абсорбции представляет собой алкилсахарид.

46. Фармацевтическая композиция по п. 45, отличающаяся тем, что алкилсахарид выбран из додецил мальтозида, тетрадецил мальтозида (TDM) и додеканоата сахарозы.

47. Фармацевтическая композиция по п. 46, отличающаяся тем, что алкилсахарид представляет собой Intravail® (додецил мальтозид).

48. Фармацевтическая композиция по п. 47, отличающаяся тем, что интраназальная композиция содержит в диапазоне от около 0,05% до около 2,5% Intravail® (додецил мальтозид).

49. Фармацевтическая композиция по п. 48, отличающаяся тем, что интраназальная композиция содержит в диапазоне от около 0,1% до около 0,5% Intravail® (додецил мальтозид).

50. Фармацевтическая композиция по п. 49, отличающаяся тем, что интраназальная композиция содержит около 0,25% Intravail® (додецил мальтозида).

51. Фармацевтическая композиция по п. 44, отличающаяся тем, что усилитель абсорбции представляет собой бензалкония хлорид.

52. Фармацевтическая композиция по п. 51, отличающаяся тем, что интраназальная композиция содержит от около 0,005% до около 0,015% бензалкония хлорида.

53. Фармацевтическая композиция по п. 52, отличающаяся тем, что интраназальная композиция содержит около 0,01% бензалкония хлорида.

RU 2022103366 A

RU 2022103366 A

54. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 37-53, отличающаяся тем, что интраназальная композиция дополнительно содержит один или несколько наполнителей, выбранных из натрия хлорида, бензалкония хлорида, динатрия эдетата и кислоты.

55. Фармацевтическая композиция по п. 54, отличающаяся тем, что кислоты достаточно для достижения pH 3,5-5,5.

56. Многодозовое устройство, предназначенное для назальной доставки фармацевтической композиции субъекту, страдающему алкогольной зависимостью, содержащее множество доз, каждая из которых содержит количество налтрексона или его фармацевтически приемлемой соли, терапевтически эффективное для лечения алкогольной зависимости.

57. Устройство по п. 56, дополнительно содержащее счетчик доз.

558. Устройство по п. 56, отличающееся тем, что фармацевтическая композиция приготовлена в виде водного раствора.

59. Устройство по п. 56, сконфигурированное для введения каждой дозы в виде однократного введения в одно носовое отверстие.

60. Устройство по п. 56, сконфигурированное для введения каждой дозы в виде двух введений, по одному в каждое носовое отверстие.

61. Устройство по п. 56, сконфигурированное для введения каждой дозы в виде четырех введений, по два в каждое носовое отверстие.

62. Устройство по любому из пп. 56-61, содержащее в каждой дозе от около 2,5 до около 12 мг налтрексона или его соли или гидрата.

63. Устройство по п. 62, содержащее в каждой дозе от около 2,5 до около 8 мг налтрексона или его соли или гидрата.

64. Устройство по п. 63, содержащее в каждой дозе около 4 мг налтрексона или его соли или гидрата.

65. Устройство по любому из пп. 56-64, отличающееся тем, что субъекту в каждой дозе доставляют от около 0,05 до около 0,2 мл указанной композиции.

66. Устройство по п. 65, отличающееся тем, что субъекту в каждой дозе доставляют около 0,1 мл указанной композиции.

67. Устройство по п. 65, отличающееся тем, что указанный состав имеет концентрацию 40 мг/мл.

68. Устройство по любому из пп. 56-67, отличающееся тем, что интраназальная композиция дополнительно содержит усилитель абсорбции.

69. Устройство по п. 68, отличающееся тем, что усилитель абсорбции выбран из группы, состоящей из бензалкония хлорида, хитозанов, циклодекстринов, дезоксихолевой кислоты, додецил мальтозида, гликохолевой кислоты, лаурета-9, таурохолевой кислоты и тауродигидрофузидовой кислоты.

70. Устройство по п. 68, отличающееся тем, что усилитель абсорбции представляет собой алкилсахарид.

71. Устройство по п. 70, отличающееся тем, что алкилсахарид выбран из додецил мальтозида, тетрадецил мальтозида (TDM) и додеканоата сахарозы.

72. Устройство по п. 71, отличающееся тем, что алкилсахарид представляет собой Intravail® (додецил мальтозид).

73. Устройство по п. 69, отличающееся тем, что интраназальная композиция содержит в диапазоне от около 0,05% до около 2,5% Intravail® (додецил мальтозид).

74. Устройство по п. 73, отличающееся тем, что интраназальная композиция содержит в диапазоне от около 0,1% до около 0,5% Intravail® (додецил мальтозид).

75. Устройство по п. 74, отличающееся тем, что интраназальная композиция содержит около 0,25% Intravail® (додецил мальтозида).

RU 2022103366 A

RU 2022103366 A

76. Устройство по п. 71, отличающееся тем, что усилитель абсорбции представляет собой бензалкония хлорид.

77. Устройство по п. 69, отличающееся тем, что интраназальная композиция содержит от около 0,005% до около 0,015% бензалкония хлорида.

78. Устройство по п. 77, отличающееся тем, что интраназальная композиция содержит около 0,01% бензалкония хлорида.

79. Устройство любому из пп. 56-78, отличающееся тем, что интраназальная композиция дополнительно содержит один или несколько вспомогательных веществ, выбранных из натрия хлорида, бензалкония хлорида, динатрия эдетата и кислоты.

80. Устройство по п. 79, отличающееся тем, что кислоты достаточно для достижения pH 3,5-5,5.

RU 2022103366 A

RU 2022103366 A