

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2017145643, 27.05.2016

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

28.05.2015 US 14/723,996;

16.11.2015 US 62/255,805

(43) Дата публикации заявки: 28.06.2019 Бюл. № 19

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 28.12.2017

(86) Заявка РСТ:

IB 2016/000857 (27.05.2016)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2016/189393 (01.12.2016)

Адрес для переписки:

109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО

"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

ЛУМОСА ТЕРАПЬЮТИКС КО., ЛТД.  
(CN),ШАНХАЙ ЛУМОСА ТЕРАПЬЮТИКС  
КО., ЛТД. (CN)

(72) Автор(ы):

ЛИ Чань-Цзюнь (CN),

ЧОУ Дейвид Чи-Куан (US),

ХУАН Цзинь-Дин (CN),

ТСАЙ Шинь младший (CN),

КО Шу-Вень (CN),

ТЕНЬ Юй-Энь (CN)

(54) **ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ ДЛЯ ПРОЛОНГИРОВАННОГО ВЫСВОБОЖДЕНИЯ СЕБАКОИЛ-ДИНАЛБУФИНОВОГО ЭФИРА**

## (57) Формула изобретения

1. Фармацевтическая композиция, содержащая пролекарство сложного эфира налбуфина, растворенное в фармацевтически приемлемом масле и смешиваемом с маслом удерживающем растворителе,

где концентрация пролекарства сложного эфира налбуфина в композиции превышает растворимость пролекарства сложного эфира налбуфина при добавлении в смесь фармацевтически приемлемого масла и смешиваемого с маслом удерживающего растворителя, и/или

где массовое отношение смешиваемого с маслом удерживающего растворителя к фармацевтически приемлемому маслу равно или больше примерно 1,1:1.

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, где пролекарством сложного эфира налбуфина является себакоил-диналбуфиновый эфир (СДЭ).

3. Фармацевтическая композиция по п. 2, где растворимость СДЭ в смешиваемом с маслом удерживающем растворителе равна или больше примерно 100 мг/мл.

4. Фармацевтическая композиция по п. 2, где концентрация СДЭ в композиции равна или больше примерно 70 мг/мл.

5. Фармацевтическая композиция по п. 1, где фармацевтически приемлемым маслом является соевое масло, арахисовое масло, кунжутное масло, или их смесь; а смешиваемым с маслом удерживающим растворителем является бензилбензоат,





включающей пролекарство сложного эфира налбуфина, с предварительно определенным периодом высвобождения, включающий этапы:

(1) обеспечения смешиваемого с маслом удерживающего растворителя и фармацевтически приемлемого масла, где массовое отношение смешиваемого с маслом удерживающего растворителя к фармацевтически приемлемому маслу регулируют на основе предварительно определенного периода высвобождения; и

(2) смешивания пролекарства сложного эфира налбуфина со смешиваемым с маслом удерживающим растворителем и фармацевтически приемлемым маслом, до получения однородного раствора.

37. Способ по п. 36, где этап (2) включает вначале смешивание пролекарства сложного эфира налбуфина со смешиваемым с маслом удерживающим растворителем до получения прозрачного раствора, а затем смешивание прозрачного раствора с фармацевтически приемлемым маслом.

38. Способ по п. 36, где этап (2) включает смешивание пролекарства сложного эфира налбуфина со смесью смешиваемого с маслом удерживающего растворителя и фармацевтически приемлемого масла.

39. Способ по п. 36, где предварительно определенный период высвобождения составляет больше примерно 14 суток, а массовое отношение смешиваемого с маслом удерживающего растворителя к фармацевтически приемлемому маслу составляет больше примерно 1.

40. Способ по п. 36, где предварительно определенный период высвобождения составляет меньше примерно 14 суток, а массовое отношение смешиваемого с маслом удерживающего растворителя к фармацевтически приемлемому маслу составляет меньше примерно 1.

41. Применение терапевтически эффективного количества фармацевтической композиции по п. 8 для лечения боли у субъекта, нуждающегося в этом, где фармацевтическую композицию вводят посредством внутримышечной инъекции за 6-36 часов до развития болевых симптомов.

42. Применение по п. 41, где болевые симптомы развиваются во время или после хирургической операции у субъекта.

43. Применение по п. 41, где фармацевтическую композицию вводят для доставки общей дозы примерно до 160 мг СДЭ.

А  
3  
4  
5  
6  
7  
1  
1  
0  
2  
R  
U

R  
U  
2  
0  
1  
7  
1  
4  
5  
6  
4  
3  
A