

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

(21)(22) Заявка: 2012116880/15, 29.10.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
30.10.2009 US 12/609,799

(43) Дата публикации заявки: 10.12.2013 Бюл. № 34

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 30.05.2012(86) Заявка РСТ:
EP 2010/066429 (29.10.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/051422 (05.05.2011)Адрес для переписки:
191036, Санкт-Петербург, а/я 24, "НЕВИНПАТ"

(71) Заявитель(и):

Дженерал Электрик Компани (US)

(72) Автор(ы):

БЭЙЛС Брайан К. (US),

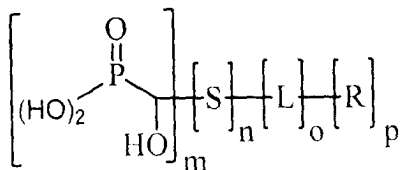
ХЭЙ Брюс Алан (US),

КАНДАПАЛЛИЛ Бинил Айтти Айпе (US)

(54) **ОБРАБОТКА НЕРАСТВОРИМЫХ В ВОДЕ НАНОЧАСТИЦ ГИДРОФИЛЬНЫМИ
КОНЬЮГАТАМИ АЛЬФА-ГИДРОКСИФОСФОНОВОЙ КИСЛОТЫ, МОДИФИЦИРОВАННЫЕ
ТАКИМ ОБРАЗОМ НАНОЧАСТИЦЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ КОНТРАСТНЫХ
АГЕНТОВ**

(57) Формула изобретения

1. Композиция, содержащая:
нерастворимую в воде наночастицу, к которой присоединена по меньшей мере одна
альфа-гидроксифосфонатная группировка, имеющая формулу:



где S представляет собой спейсер, L представляет собой связь между S и R, R
представляет собой полимерную гидрофильную группировку, m и p равны 1-5, и n и o
равны 0-5.

2. Композиция по п.1, где R представляет собой полимерную гидрофильную
группировку на основе этиленоксидных единиц.

3. Композиция по п.1 или 2, где полимерные гидрофильные группировки основаны
на этиленоксиде, и где поли(этиленоксид) имеет молекулярную массу, равную или
меньше 5000 Да.

4. Композиция по п.1, где наночастица представляет собой суперпарамагнитную
наночастицу на основе оксида железа.

5. Композиция по п.1, дополнительно содержащая фармацевтически приемлемый носитель или эксципиент.

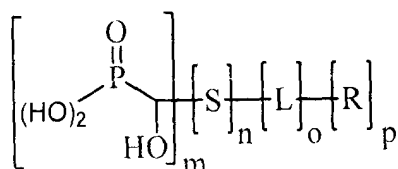
6. Композиция по п.5 для применения в качестве контрастного агента МРВ (магнитно-резонансная визуализация), подходящего для инъектирования субъекту-человеку.

7. Способ использования нерастворимых в воде наночастиц, к которым присоединены альфа-гидроксифосфонатные группировки, в диагностической визуализации, включающий

а) введение указанных наночастиц субъекту; и

б) подвергание указанного субъекта диагностической визуализации, при которой указанные наночастицы действуют в качестве контрастного агента.

8. Способ по п.7, где альфа-гидроксифосфонатные группировки имеют формулу:



где S представляет собой спейсер, L представляет собой связь между S и R, R представляет собой полимерную гидрофильную группировку, m и p равны 1-5, и n и o равны 0-5.

9. Способ по п.8, где R представляет собой полимерную гидрофильную группировку на основе этиленоксидных единиц.

10. Способ по п.9, где полимерные гидрофильные группировки основаны на этиленоксиде, и где поли(этиленоксид) имеет молекулярную массу, равную или меньше 5000 Да.

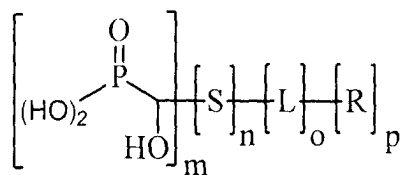
11. Способ по любому из пп.7-10, где наночастица представляет собой суперпарамагнитную наночастицу на основе оксида железа.

12. Способ изготовления нерастворимых в воде наночастиц, к которым присоединены альфа-гидроксифосфонатные группировки, включающий:

а) получение суспензии наночастицы в суспензионном агенте; и

б) приведение указанной суспензии в контакт с указанными альфа-гидроксифосфонатными группировками.

13. Способ по п.12, где альфа-гидроксифосфонатные группировки имеют формулу:



где S представляет собой спейсер, L представляет собой связь между S и R, R представляет собой полимерную гидрофильную группировку, m и p равны 1-5, и n и o равны 0-5.

14. Способ по п.13, где R представляет собой гидрофильную группировку на основе этиленоксидных единиц.

15. Способ по п.14, где полимерные гидрофильные группировки основаны на этиленоксиде, и где поли(этиленоксид) имеет молекулярную массу, равную или меньше 5000 Да.