

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2015114996, 27.09.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
27.09.2012 US 61/706,164

(43) Дата публикации заявки: 20.11.2016 Бюл. № 32

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 27.04.2015(86) Заявка РСТ:  
US 2013/062227 (27.09.2013)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2014/052780 (03.04.2014)Адрес для переписки:  
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО  
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры"(71) Заявитель(и):  
АРАТАНА ТЕРАПЬЮТИКС, ИНК. (US)(72) Автор(ы):  
ЗОЛЛЕРС Билл (US),  
РОДЕС Линда (US),  
ХАЙНЕН Эрнст (US),  
ДЕВАРАДЖ Гопинатх (NZ)A  
2015114996 A  
RU(54) КОМПОЗИЦИИ И СПОСОБЫ ПРИМЕНЕНИЯ СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ БОРЬБЫ С  
ОТСУТСТВИЕМ АППЕТИТА

## (57) Формула изобретения

1. Способ лечения отсутствия аппетита у животного-компаньона, включающий стадию введения терапевтически эффективного количества содержащей капроморелин композиции животному-компаньону.

2. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество содержащей капроморелин композиции вводят перорально животному-компаньону.

3. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество содержащей капроморелин композиции включает количество капроморелина, достаточное для достижения C<sub>max</sub>, составляющей приблизительно 150 нанограмм капроморелина или его метаболита на миллилитр плазмы, в T<sub>max</sub>, равный приблизительно двум часам.

4. Способ по п. 1, где содержащая капроморелин композиция, кроме того, включает корригент или маскирующее вкус средство.

5. Способ по п. 4, где корригент или маскирующее вкус средство выбирают из группы, состоящей из подсластителя, соленого вещества, горького вещества, подкисливающего средства и их комбинаций.

6. Способ по п. 5, где подсластитель выбирают из группы, состоящей из Тауматина T200X, ребаудиозида А стевии, MagnaSweet®, сукралозы, Talin-Pure, OptisweetSD, содержащей ваниль композиции и их комбинаций.

7. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество содержащей капроморелин композиции вводят, используя способ, выбираемый из группы, состоящей

R U  
2 0 1 5 1 1 4 9 9 6 A

из аэрозоля, шприца, пилюли, таблетки, имплантата, пластыря и пленки.

8. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество содержащей капроморелин композиции вводят внутривенно животному-компаньону.

9. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество содержащей капроморелин композиции вводят животному-компаньону по меньшей мере один раз в день.

10. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество содержащей капроморелин композиции вводят животному-компаньону по меньшей мере дважды в день.

11. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество вводят на протяжении периода лечения, составляющего по меньшей мере один день.

12. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество вводят на протяжении периода лечения, составляющего по меньшей мере одну неделю.

13. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество вводят на протяжении периода лечения, составляющего по меньшей мере две недели.

14. Способ по п. 1, где терапевтически эффективное количество содержащей капроморелин композиции вводят на протяжении периода лечения, составляющего по меньшей мере один месяц.

15. Способ по п. 1, где содержащая капроморелин композиция включает капроморелин в концентрации от приблизительно 0,2 мг до приблизительно 6 мг на килограмм веса тела животных-компаньонов.

16. Способ по п. 1, где содержащая капроморелин композиция включает капроморелин в концентрации от приблизительно 3 мг до приблизительно 6 мг на килограмм веса тела животных-компаньонов.

17. Способ по п. 1, где содержащая капроморелин композиция включает капроморелин в концентрации от приблизительно 3 мг до приблизительно 4,5 мг на килограмм веса тела животных-компаньонов.

18. Способ по п. 1, где животным-компаньоном является кошка.

19. Способ по п. 1, где животным-компаньоном является собака.

20. Способ по п. 1, где животным-компаньоном является лошадь.

21. Способ по п. 1, где терапевтически эффективную дозу содержащей капроморелин композиции назначают в сочетании с химиотерапевтической схемой.

22. Способ по п. 1, где введение содержащей капроморелин композиции выбирают из группы, состоящей из перорального введения, внутримышечного введения и подкожного введения.

23. Способ по п. 1, где содержащая капроморелин композиция находится в жидкой лекарственной форме.

24. Способ по п. 23, где жидкую лекарственную форму или распыляют на пищевой продукт, или вводят с использованием шприца.

25. Способ по п. 1, где содержащую капроморелин композицию включают в пищевой продукт, лакомство или леденец.

26. Способ по п. 1, где сухая мышечная масса у животного-компаньона увеличивается на по меньшей мере 5%.

27. Способ по п. 1, где сухая мышечная масса у животного-компаньона увеличивается на по меньшей мере 10%.

28. Способ по п. 1, где животное-компаньон увеличивает потребление пищи на по меньшей мере 50% по сравнению с отсутствием потребления пищи.

29. Способ по п. 1, где животное-компаньон увеличивает потребление пищи на по меньшей мере 100% по сравнению с отсутствием потребления пищи.

30. Способ увеличения сухой мышечной массы и лечения отсутствия аппетита у

животного, не являющегося человеком, включающий введение терапевтически эффективной дозы содержащей капроморелин композиции животному, не являющемуся человеком.

31. Способ по п. 30, где терапевтически эффективная доза содержащей капроморелин композиции включает количество капроморелина, достаточное для достижения С<sub>max</sub>, составляющей приблизительно 150 нанограмм капроморелина или его метаболита на миллилитр плазмы, в Т<sub>max</sub>, равный приблизительно двум часам.

32. Способ по п. 30, где сухая мышечная масса увеличивается на по меньшей мере 5% после введения содержащей капроморелин композиции животному, не являющемуся человеком.

33. Способ по п. 30, где сухая мышечная масса увеличивается на по меньшей мере 10% после введения содержащей капроморелин композиции животному, не являющемуся человеком.

34. Способ по п. 30, где терапевтически эффективную дозу содержащей капроморелин композиции назначают в сочетании с химиотерапевтической схемой.

35. Способ по п. 30, где животное, не являющееся человеком, выбирают из группы, состоящей из собаки, кошки и лошади.

36. Способ по п. 30, где потребление пищи животным, не являющимся человеком, увеличивается после введения терапевтически эффективной дозы содержащей капроморелин композиции.

37. Способ по п. 36, где потребление пищи животным, не являющимся человеком, увеличивается на по меньшей мере 50% по сравнению с отсутствием потребления пищи.

38. Способ по п. 36, где потребление пищи животным, не являющимся человеком, увеличивается на по меньшей мере 100%.

39. Способ по п. 30, где содержащая капроморелин композиция включает капроморелин в концентрации от приблизительно 0,2 мг до приблизительно 6 мг на килограмм веса тела животного, не являющегося человеком.

40. Способ по п. 30, где содержащая капроморелин композиция включает один или более корригентов или маскирующих вкус средств.

41. Способ по п. 40, где корригент или маскирующее вкус средство выбирают из группы, состоящей из подсластителя, соленого вещества, горького вещества и подкисливающего средства.

42. Способ по п. 41, где подсластитель выбирают из группы, состоящей из Тауматина T200X, ребаудиозида А стевии, MagnaSweet®, сукралозы, Talin-Pure, OptisweetSD и содержащей ваниль композиции.

43. Способ по п. 30, где содержащая капроморелин композиция, кроме того, включает по меньшей мере один эмульгатор.

44. Способ по п. 30, где введение содержащей капроморелин композиции выбирают из группы, состоящей из использования шприца, пилюли, имплантата, аэрозоля, раствора для перорального введения, таблетки и пленки.

45. Способ по п. 30, где содержащую капроморелин композицию вводят по меньшей мере один раз в день.

46. Способ по п. 30, где содержащую капроморелин композицию вводят по меньшей мере дважды в день.

47. Способ по п. 30, где содержащую капроморелин композицию вводят в течение по меньшей мере одной недели.

48. Способ по п. 30, где содержащую капроморелин композицию вводят в течение по меньшей мере двух недель.

49. Способ лечения вызванной отсутствием аппетита потери веса у животного, не являющегося человеком, включающий стадии:

R U 2 0 1 5 1 1 4 9 9 6 A

диагностирования у животного, не являющегося человеком, наличия вызванной отсутствием аппетита потери веса,

введения по меньшей мере одной дозы содержащей капроморелин композиции животному, не являющемуся человеком, и

слежения за по меньшей мере одним показателем или маркером в плазме у животного, не являющегося человеком.

50. Способ по п. 49, дополнительно включающий стадию введения дополнительных доз содержащей капроморелин композиции животному, не являющемуся человеком, до момента времени, когда показатель или маркер в плазме или увеличится, или уменьшится в ответ на дозу капроморелина.

51. Способ по п. 49, где по меньшей мере один маркер в плазме выбирают из группы, состоящей из инсулиноподобного фактора-1 роста, кортизола, веса тела животного, не являющегося человеком, и капроморелина.

52. Способ по п. 51, где инсулиноподобный фактор-1 роста, кортизол и капроморелин увеличиваются у животного, получающего содержащую капроморелин композицию.

53. Способ по п. 49, где показатель выбирают из группы, состоящей из величины потребления пищи, увеличения веса, потери веса и увеличения сухой мышечной массы.

54. Способ по п. 53, в котором показателем является потеря веса, и содержащую капроморелин композицию вводят до прибавления у животного достаточной величины веса.

55. Способ по п. 49, где по меньшей мере одна доза содержащей капроморелин композиции включает количество капроморелина, достаточное для достижения С<sub>max</sub>, составляющей приблизительно 150 нанограмм капроморелина или его метаболита на миллилитр плазмы, в Т<sub>max</sub>, равный приблизительно двум часам.

56. Способ по п. 49, где доза содержащей капроморелин композиции включает концентрацию, составляющую от приблизительно 0,2 мг до приблизительно 6 мг капроморелина на килограмм веса тела животного, не являющегося человеком.

57. Способ по п. 49, где по меньшей мере одну дозу в день содержащей капроморелин композиции вводят животному, не являющемуся человеком.

58. Способ по п. 49, где по меньшей мере две дозы в день содержащей капроморелин композиции вводят животному, не являющемуся человеком.

59. Способ по п. 49, где содержащую капроморелин композицию вводят в течение по меньшей мере одной недели.

60. Способ по п. 49, где содержащую капроморелин композицию вводят в течение по меньшей мере двух недель.

61. Способ по п. 49, где содержащую капроморелин композицию вводят путем, выбираемым из группы, состоящей из перорального пути и парентерального пути.

62. Способ по п. 49, где содержащая капроморелин композиция, кроме того, включает корригент или маскирующее вкус средство.

63. Способ по п. 62, где корригент или маскирующее вкус средство выбирают из группы, состоящей из подсластителя, соленого вещества, горького вещества, подкисливающего средства и их комбинаций.

64. Способ по п. 63, где подсластитель выбирают из группы, состоящей из Тауматина T200X, ребаудиозида А стевии, MagnaSweet®, сукралозы, Talin-Pure, OptisweetSD, содержащей ваниль композиции и их комбинаций.

65. Способ лечения потери веса у животного-компаньона, включающий стадии: определения того, что у животного-компаньона наблюдается потеря веса, введения по меньшей мере одной дозы содержащей капроморелин композиции животному-компаньону, используя шприц, и

оценки одного или более маркеров в плазме или показателей у животного-компаньона.

66. Способ по п. 65, где один или более маркеров у животного-компаньона выбирают из группы, состоящей из изменения веса животного-компаньона, изменения потребления пищи животным-компаньоном и изменения сухой мышечной массы.

67. Способ по п. 65, дополнительно включающий стадию введения дополнительных доз содержащей капроморелин композиции

животному, не являющемуся человеком, до момента времени, когда показатель или маркер в плазме не будет находиться на соответствующем уровне.

68. Способ по п. 65, в котором показателем является потеря веса, и содержащую капроморелин композицию вводят до прибавления у животного достаточной величины веса.

69. Способ по п. 65, где по меньшей мере одну дозу в день содержащей капроморелин композиции вводят животному-компаньону.

70. Способ по п. 65, где по меньшей мере две дозы в день содержащей капроморелин композиции вводят животному-компаньону.

71. Способ по п. 65, где один или более маркеров в плазме выбирают из группы, состоящей из инсулиноподобного фактора-1 роста, кортизола и капроморелина.

72. Способ по п. 65, где оценка одного или более маркеров в плазме включает определение минимального количества маркера в кровотоке животного.

73. Способ по п. 65, дополнительно включающий стадию увеличения или уменьшения дозы капроморелина с учетом минимального количества маркера в плазме в кровотоке животного.

74. Способ по п. 65, где оценка одного или более маркеров в плазме или показателей происходит по меньшей мере один раз в первую неделю после введения содержащей капроморелин композиции.

75. Способ по п. 65, где введение содержащей капроморелин композиции выбирают из группы, состоящей из перорального введения, внутримышечного введения и под кожного введения.

76. Способ по п. 65, где содержащая капроморелин композиция, кроме того, включает корригент или маскирующее вкус средство.

77. Способ по п. 76, где корригент или маскирующее вкус средство выбирают из группы, состоящей из подсластителя, соленого вещества, горького вещества, подкисливающего средства и их комбинаций.

78. Способ по п. 77, где подсластитель выбирают из группы, состоящей из Тауматина T200X, ребаудиозида А стевии, MagnaSweet®, сукралозы, Talin-Pure, OptisweetSD, содержащей ваниль композиции и их комбинаций.

79. Фармацевтическая композиция для лечения отсутствия аппетита у животного, не являющегося человеком, включающая: терапевтически эффективное количество капроморелина и по меньшей мере один носитель.

80. Фармацевтическая композиция по п. 79, где терапевтически эффективное количество капроморелина включает концентрацию, составляющую от приблизительно 0,2 мг до приблизительно 6 мг капроморелина на килограмм веса тела животного, не являющегося человеком.

81. Фармацевтическая композиция по п. 79, дополнительно включающая компонент, выбранный из группы, состоящей из эмульгатора или загустителя.

82. Фармацевтическая композиция по п. 79, дополнительно включающая компонент, выбранный из группы, состоящей из корригента, маскирующего вкус средства и их комбинаций.

83. Фармацевтическая композиция по п. 82, где корригент или маскирующее вкус средство выбраны из группы, состоящей из подсластителя, соленого вещества, горького вещества, подкисливающего средства и их комбинаций.
84. Фармацевтическая композиция по п. 83, где подсластитель выбран из группы, состоящей из Тауматина T200X, ребаудиозида А стевии, MagnaSweet®, сукралозы, Talin-Pure, OptisweetSD, содержащей ваниль композиции их комбинаций.
85. Фармацевтическая композиция по п. 79, где фармацевтическая композиция содержится в шприце.
86. Фармацевтическая композиция по п. 79, где фармацевтическая композиция приготовлена для перорального введения.
87. Фармацевтическая композиция по п. 79, где композиция находится в форме раствора или супспензии.
88. Фармацевтическая композиция по п. 79, где носитель включает физиологический раствор.
89. Фармацевтическая композиция по п. 79, где фармацевтическая композиция приготовлена для внутривенного введения.
90. Фармацевтическая композиция по п. 79, где фармацевтическая композиция приготовлена для подкожного введения.
91. Фармацевтическая композиция по п. 79, где фармацевтическая композиция приготовлена в виде по меньшей мере одного из следующего: пленки, пластыря, аэрозоля, имплантата и суппозитория.
92. Способ лечения вызванной отсутствием аппетита потери веса у животного-компаньона, включающий стадии:
- перорального введения фармацевтической композиции, содержащей капроморелин, животному-компаньону, используя шприц, и определения эффективности фармацевтической композиции посредством слежения за одним или более маркеров в плазме или показателей у животного-компаньона.
93. Способ по п. 92, где фармацевтическую композицию вводят животному-компаньону по меньшей мере один раз в день.
94. Способ по п. 92, где фармацевтическая композиция включает капроморелин в концентрации от приблизительно 0,2 мг до приблизительно 6 мг на килограмм веса тела животного-компаньона или скота.
95. Способ по п. 92, где один или более показателей выбирают из группы, состоящей из изменения веса тела животного-компаньона и изменения потребления пищи животным-компаньоном.
96. Способ по п. 92, где введение фармацевтической композиции выбирают из группы, состоящей из внутривенного, внутримышечного и подкожного введения.
97. Фармацевтическая композиция для перорального введения для лечения отсутствия аппетита у животного-компаньона, включающая:
- терапевтически эффективное количество капроморелина и корригент или маскирующее вкус средство, где терапевтически эффективное количество капроморелина включает концентрацию, составляющую от приблизительно 0,2 мг до приблизительно 6 мг капроморелина на килограмм веса тела животного.
98. Фармацевтическая композиция для перорального введения по п. 97, дополнительно включающая по меньшей мере одно из следующего: корригент или маскирующее вкус средство.
99. Фармацевтическая композиция для перорального введения по п. 98, где корригент или маскирующее вкус средство выбирают из группы, состоящей из подсластителя, соленого вещества, горького вещества и подкисливающего средства.

100. Фармацевтическая композиция для перорального введения по п. 99, где подсластитель включает по меньшей мере одно из следующего: Тауматин Т200Х, ребаудиозид А стевии, MagnaSweet®, сукралозу, Talin-Pure, OptisweetSD и содержащую ваниль композицию.

101. Фармацевтическая композиция для перорального введения по п. 97, где фармацевтическая композиция, кроме того, включает носитель.

102. Фармацевтическая композиция для перорального введения по п. 97, дополнительно включающая по меньшей мере одно из следующего: эмульгатор и загуститель.

103. Фармацевтическая композиция для перорального введения по п. 97, где композиция включена в продукт, выбранный из группы, состоящей из лакомства, леденца и пищевого продукта.

104. Фармацевтическая композиция для перорального введения по п. 97, где животным-компаньоном является кошка или собака.

105. Способ лечения или профилактики липидоза печени у животного-компаньона, включающий стадии введения терапевтически эффективного количества содержащей капроморелин композиции животному-компаньону.

106. Способ по п. 105, где животным-компаньоном является кошка.

107. Способ по п. 105, где содержащую капроморелин композицию вводят перорально.

108. Способ по п. 105, где содержащую капроморелин композицию вводят животному-компаньону по меньшей мере один раз в день.

109. Способ по п. 105, где содержащую капроморелин композицию вводят животному-компаньону по меньшей мере два раза в день.

110. Способ по п. 105, где содержащая капроморелин композиция включает капроморелин в концентрации от приблизительно 2 мг до приблизительно 4 мг на килограмм веса

тела животных-компаньонов.

111. Набор, используемый для лечения отсутствия аппетита у животных, не являющихся людьми, при этом набор включает:

шприц,

сосуд, содержащий фармацевтический состав, включающий содержащую капроморелин композицию, и

инструкции, которые информируют пользователя о заборе приблизительно одной дозы фармацевтического состава из сосуда с помощью шприца и введении фармацевтической композиции животному, не являющемуся человеком, с помощью шприца.

112. Набор по п. 111, где фармацевтический состав приготовлен для перорального введения.

113. Набор по п. 111, где набор включает инструкции, что фармацевтический состав должен вводиться животным, не являющимся людьми, по меньшей мере один раз в день.

114. Способ сохранения веса тела у животного-компаньона, включающий введение некоторого количества содержащей капроморелин композиции и корригента или маскирующего вкус средства животному-компаньону, которое является достаточным для сохранения веса тела животного-компаньона.

115. Фармацевтический состав, включающий:

носитель и

содержащую капроморелин композицию, где содержащая капроморелин композиция включает количество капроморелина, достаточное для достижения  $C_{max}$ , составляющей

R U 2 0 1 5 1 1 4 9 9 6 A

A  
4 9 9 6  
1 1 5 1  
2 0 1 1  
R U

приблизительно 150 нанограмм капроморелина или его метаболита на миллилитр плазмы, в Tmax, равный приблизительно двум часам.

116. Фармацевтический состав, включающий:

носитель и

содержащую капроморелин композицию, где содержащая капроморелин композиция включает количество капроморелина, достаточное для достижения Cmax, составляющей приблизительно 905 нанограмм капроморелина или его метаболита на миллилитр плазмы, в Tmax, равный приблизительно двадцати пяти минутам.

117. Способ увеличения сухой мышечной массы у скота, включающий стадию введения содержащей капроморелин композиции нуждающемуся в этом животному.

118. Способ по п. 117, где содержащая капроморелин

композиция, кроме того, включает корригент или маскирующее вкус средство.

119. Способ по п. 118, где корригент или маскирующее вкус средство выбирают из группы, состоящей из Тауматина T200X, ребаудиозида А стевии, MagnaSweet®, сукралозы, Talin-Pure, OptisweetSD, содержащей ваниль композиции и их комбинаций.

120. Способ по п. 117, где содержащую капроморелин композицию смешивают с кормом.

121. Способ по п. 120, где содержащую капроморелин композицию вводят по меньшей мере дважды в день.

122. Способ по п. 120, где сухая мышечная масса у животного увеличивается на по меньшей мере 5%.

123. Способ по п. 120, где сухая мышечная масса у животного увеличивается на по меньшей мере 10%.

124. Способ по п. 120, где содержащую капроморелин композицию вводят в течение по меньшей мере 1 недели.

125. Способ по п. 120, где содержащую капроморелин композицию вводят в течение по меньшей мере 2 недель.

126. Способ по п. 120, где скот выбирают из группы, состоящей из коров различных видов, овец различных видов, свиней различных видов, птиц различных видов и животных, используемых в качестве источника пищи.

127. Способ сохранения потребления пищи, включающий стадии:

получения жидкого состава содержащей капроморелин композиции, включающей капроморелин и корригент или маскирующее вкус средство;

распыления жидкого состава на пищевой продукт и

кормления животного пищевым продуктом.

128. Способ по п. 127, где способ позволяет животному потреблять такое количество пищи, которое поддерживает вес животного.

129. Фармацевтическая композиция, включающая:

капроморелин в концентрации, составляющей от приблизительно 0,2 мг до приблизительно 4 мг на килограмм веса тела животного,

корригент или маскирующее вкус средство, и

носитель.