



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012126143/15, 22.12.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
23.12.2009 US 61/289,507

(43) Дата публикации заявки: 27.01.2014 Бюл. № 3

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 23.07.2012(86) Заявка РСТ:  
AU 2010/001719 (22.12.2010)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/075775 (30.06.2011)Адрес для переписки:  
109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО  
"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

**ФОСФЕЙДЖЕНИКС ЛИМИТЕД (AU)**

(72) Автор(ы):

**ГЕЙВИН Пол Дейвид (AU),  
ЭЛЬ-ТАМИМИ Махмуд (AU),  
КОТРЕЛЛ Джереми Джеймс (AU),  
ГАЭТАНО Джасинто (AU),  
КЕННЕДИ Николас Джон (AU)**(54) **КОМПОЗИЦИЯ НОСИТЕЛЯ**(57) **Формула изобретения**

1. Композиция носителя для доставки биологически активного соединения, содержащего фосфатное соединение в качестве агента переноса электронов и полярный протонный растворитель, выбранный из группы, состоящей из ациклических спиртов, сложных алкильных эфиров, кетонов и нитрилов, в которой концентрация полярного протонного растворителя составляет около 60-90% масс. общей концентрации композиции носителя.

2. Композиция носителя по п.1, в котором концентрация полярного протонного растворителя составляет около 65-85% масс., около 70-80% масс., или около 50-60% масс., или около 60-70% масс., или около 80-90% масс.

3. Композиция носителя по п.1, в которой полярный протонный растворитель является ациклическим спиртом.

4. Композиция носителя по п.3, в которой ациклический спирт выбран из группы, состоящей из C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> ациклических спиртов, полиолов C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> ациклических спиртов, полимеров C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> ациклических спиртов и сложных эфиров, алкильных сложных эфиров и их производных простых эфиров.

5. Композиция носителя по п.3, в которой ациклический спирт является этанолом, n-пропанолом, изопропанолом, этиленгликолем, пропиленгликолем, полиэтиленгликолем, моноэтиловым эфиром диэтиленгликоля или этилацетатом.

6. Композиция носителя по п.1, в которой полярный протонный растворитель является

кетонном.

7. Композиция носителя по п.6, в которой кетон является метилизобутилкетонном или ацетоном.

8. Композиция носителя по п.1, в которой полярный протонный растворитель является нитрилом.

9. Композиция носителя по п.8, в которой нитрил является ацетонитрилом.

10. Композиция носителя по п.1, в которой агент переноса электрона является гидроксихроманом.

11. Композиция носителя по п.10, в которой гидроксихроман является токоферолом или токотриенолом.

12. Композиция носителя по п.11, в которой фосфатное соединение токоферола выбрано из группы, состоящей из моно-(токоферил)фосфата, моносодиевой соли моно-(токоферил)фосфата, монокалиевой соли моно-(токоферил)фосфата, динатриевой соли моно-(токоферил)фосфата, дикалиевой соли моно-(токоферил)фосфата, ди-(токоферил)фосфата, моносодиевой соли ди-(токоферил)фосфата, монокалиевой соли ди-(токоферил)фосфата или их смеси.

13. Композиция носителя по п.12, в которой фосфатное соединение токоферола является смесью моно-(токоферил)фосфата с ди-(токоферил)фосфатом.

14. Композиция носителя по п.13, в которой отношение в смеси моно-(токоферил)фосфата к ди-(токоферил)фосфатом составляет, по меньшей мере, 2:1 или около 4:1-1:4, или около 6:4-8:2.

15. Композиция носителя по п.1, в которой фосфатное соединение в качестве агента переноса электронов присутствует в количестве около 0,01-20% масс. или около 0,01-10% масс., или около 0,01-5% масс., или около 0,01-2% масс., или около 5-10% масс., или около 10-15% масс., или около 0,05-0,1% масс. или около 1% масс. общей концентрации композиции носителя.

16. Применение фосфатного соединения в качестве агента переноса электронов и полярного протонного растворителя, выбранного из ациклических спиртов, сложных алкильных эфиров, кетонов и нитрилов при приготовлении композиции носителя, в которой концентрация полярного протонного растворителя составляет около 60-90% масс. общей концентрации композиции носителя.

17. Способ приготовления композиции носителя по п.1, включающий стадию объединения фосфатного соединения в качестве агента переноса электронов и полярного протонного растворителя до достижения полной гомогенизации.

18. Рецептатура, включающая композицию носителя по п.1 и биологически активное соединение.

19. Рецептатура по п.18, в которой биологически активное соединение является липофильным с величиной  $\log P$  около 1-5.

20. Рецептатура по п.18, в которой биологически активное соединение обладает относительно низкой молекулярной массой и/или относительно низкой точкой.

21. Рецептатура по п.18, в которой биологически активное соединение присутствует в количестве до около 30% масс. общей концентрации композиции носителя.

22. Рецептатура по п.21, в которой биологически активное соединение выбрано из группы, состоящей из ксикаина, диклофенака, кеторолака, прилокаина, галобетазола, гидрокортизона и их комбинаций.

23. Рецептатура по п.22, в которой биологически активное соединение присутствует в количестве до 5% масс. общей концентрации композиции носителя.

24. Способ приготовления рецептуры по п.18, включающий стадию добавления биологически активного соединения к композиции носителя по п.1.

25. Применение композиции носителя по п.1 для улучшения доставки биологически

активного соединения, включенного в композицию носителя, или изменения свойств А.Д.М.Е. биологически активного соединения, или улучшения бионакопления биологически активного соединения.

26. Способ лечения патологического состояния, которое включает назначение эффективного количества биологически активного соединения, которым при необходимости в нем будут лечить патологическое состояние пациента, в котором биологически активное соединение включено в композицию носителя по п.1.

RU 2012126143 A

RU 2012126143 A