



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012133467/15, 04.02.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
05.02.2010 AU 2010900463;  
19.02.2010 US 61/306,115;  
04.06.2010 AU 2010902463

(43) Дата публикации заявки: 10.02.2014 Бюл. № 4

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 03.08.2012(86) Заявка РСТ:  
AU 2011/000122 (04.02.2011)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/094822 (11.08.2011)

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),  
ЛИБИНАКИ Роксан (AU),  
МОЗАФАРИ Мохаммад Реза (AU)**(54) **КОМПОЗИЦИЯ НОСИТЕЛЯ**(57) **Формула изобретения**

1. Композиция носителя для доставки биологически активного соединения содержащая фосфатное соединение агента передачи электронов, выбранное из группы, у состоящей из моно(токоферил)фосфата, мононатриевой соли моно(токоферил)фосфата, динатриевой соли моно(токоферил)фосфата, ди(токоферил)фосфата, мононатриевой соли ди(токоферил)фосфата или их смеси, и растворитель, выбранный из группы, состоящей из N,N-диметилформамида (DMF), N-метил-2-пирролидона (NMP), диметилсульфоксида (DMSO), N,N-диметилацетамида (DMAC), диоксана, гексаметилфосфортриамида, пропиленкарбоната, гамма-бутиролактона, монометилового эфира уксусной кислоты, этиллактата, 1,3-диметил-2-имидазолидинона (диметилизосорбид или DMI), изопропилмиристата, рицинолеата пропиленгликоля, изононилизононаноата и эфиров жирных кислот сахарозы, изопропилпальмитата, изопропилизостеарата, диизопропиладипата, диизопропилдимерата, малеинированного соевого масла, октилпальмитата, цетиллактата, глицерина, каприлилгликоля, сквалена, бисаболола, бензилового спирта, цетилрицинолеата, цетилацетата, глицеридов зародышей пшеницы, миристиллактата, децилолеата, изопропилланолат, пентаэритритилтетрастеарата, дикаприлат/дикапрат неопентилгликоля, изононилизононаноата\*, изотридецилизононаноата, миристилмиристата, октилдодеканол и октилгидроксистеарата, причем концентрация растворителя

составляет от около 0,05 до около 30% масс. от общей концентрации композиции носителя.

2. Композиция носителя по п.1, в которой токоферилфосфат находится в не нейтрализованной форме.

3. Композиция носителя по п.2, в которой рН не нейтрализованного токоферилфосфата составляет от около 2 до около 4, от около 2 до около 3, около 2 или около 3.

4. Композиция носителя по п.1, в которой композиция носителя содержит смесь моно-(токоферил)фосфата и ди-(токоферил)фосфата в отношении, по меньшей мере, 2:1, в диапазоне от около 4:1 до около 1: 4, в диапазоне от около 6:4 до около 8:2, около 6:4 или около 8:2.

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

6. Композиция носителя по п.1, в которой фосфатное соединение агента передачи электронов содержится в количестве около 0,1% масс., около 1% масс. или около 5% масс. от общей концентрации композиции носителя.

7. Композиция носителя по п.1, в которой растворителем является N-метил-2-пирролидон (NMP), этиллактат или 1,3-диметил-2-имидазолидинон (диметилизосорбид или DMI).

8. Композиция носителя по п.1, в которой концентрация растворителя составляет от около 0,05% масс. до 20% масс., до около 10% масс., до около 5% масс., до около 3% масс., до около 2% масс. или до около 1% масс.

9. Применение фосфатного соединения агента передачи электронов, выбранного из группы, состоящей из моно(токоферил)фосфата, моносодиевой соли моно(токоферил)фосфата, динатриевой соли моно(токоферил)фосфата, ди(токоферил)фосфата, моносодиевой соли ди(токоферил)фосфата или их смеси, и растворителя, выбранного из группы, состоящей из N,N-диметилформамида (DMF), N-метил-2-пирролидона (NMP), диметилсульфоксида (DMSO), N,N-диметилацетамида (DMAC), диоксана, гексаметилфосфортриамина, пропиленкарбоната, гамма-бутиролактона, монометилового эфира уксусной кислоты, этиллактата, 1,3-диметил-2-имидазолидинона (диметилизосорбид или DMI), изопропилмиристата, рицинолеата пропиленгликоля, изононилизононаноата и эфиров жирных кислот сахарозы, изопропилпальмитата, изопропилизостеарата, диизопропиладипата, диизопропилдимерата, малеинированного соевого масла, октилпальмитата, цетиллактата, глицерина, каприлилгликоля, сквалена, бисаболола, бензилового спирта, цетилрицинолеата, цетилацетата, глицеридов зародышей пшеницы, миристиллактата, децилолеата, изопропилланолат, пентаэритритилтетрастеарата, дикаприлат/дикапрат неопентилгликоля, изононилизононаноата\*, изотридецилизононаноата, миристилмиристата, октилдодеканола и октилгидроксистеарата для получения композиции носителя для доставки биологически активного соединения, причем концентрация растворителя составляет от около 0,05 до около 30% масс, от общей концентрации композиции растворителя.

10. Способ получения композиции носителя для доставки биологически активного соединения, который включает стадию объединения фосфатного соединения агента передачи электронов, выбранного из группы, состоящей из моно(токоферил)фосфата, моносодиевой соли моно(токоферил)фосфата, динатриевой соли моно(токоферил)фосфата, ди(токоферил)фосфата, моносодиевой соли ди(токоферил)фосфата или их смеси, и растворителя, выбранного из группы, состоящей из N,N-диметилформамида (DMF), N-метил-2-пирролидона (NMP), диметилсульфоксида (DMSO), N,N-

диметилацетамида (DMAC), диоксана, гексаметилфосфортриамида, пропиленкарбоната, гамма-бутиролактона, монометилового эфира уксусной кислоты, этиллактата, 1,3-диметил-2-имидазолидинона (диметилизосорбид или DMI), изопропилмиристата, рицинолеата пропиленгликоля, изононилизононаноата и эфиров жирных кислот сахарозы, изопропилпальмитата, изопропилизостеарата, диизопропиладипата, диизопропилдимерата, малеинированного соевого масла, октилпальмитата, цетиллактата, глицерина, каприлилгликоля, сквалена, бисаболола, бензилового спирта, цетилрицинолеата, цетилацетата, глицеридов зародышей пшеницы, миристиллактата, децилолеата, изопропилланолат, пентаэритритилтетрастеарата, дикаприлат/дикапрат неопентилгликоля, изотридецилизононаноата, миристилмиристата, октилдодеканола и октилгидроксистеарата, причем концентрация растворителя составляет от около 0,05 до около 30% масс. от общей концентрации композиции растворителя.

11. Рецепттура, содержащая композицию носителя по п.1 и биологически активное соединение.

12. Рецепттура по п.11, в которой биологически активное соединение является лекарственным средством или его фармацевтически приемлемым производным, или нутрицевтиком или его нутрицевтически приемлемым производным, или космецевтиком или их космецевтически приемлемыми производными.

13. Рецепттура по п.11, в которой биологически активным соединением является лидокаин, диклофенак, кеторалак, прилокаин, галобетазол, гидрокортизол или их комбинации.

14. Рецепттура по п.11, в которой биологически активное соединение присутствует в количестве от около 0,001% масс. до около 15% масс., до около 10% масс., до около 5% масс., до около 2% масс., или до около 1% масс. от общей концентрации композиции носителя.

15. Рецепттура по п.11, в которой биологически активное соединение присутствует в количестве от около 0,001% масс. до около 0,05% масс., до около 0,1% масс., до около 1% масс., до около 2% масс., до около 5% масс. или около 1% масс., около 2% масс. или около 5% масс. от общей концентрации композиции носителя.

16. Способ получения рецептуры по п.11, который включает стадию добавления биологически активного соединения к композиции носителя по п.1.

17. Способ лечения патологического состояния пациента, где способ включает назначение эффективного количества биологически активного соединения в композиции носителя по п.1.

18. Применение композиции носителя по п.1 для доставки биологически активного соединения для лечения патологического состояния пациента.

19. Применение композиции носителя по п.1 для улучшения доставки и/или биодоступности биологически активного соединения.

20. Применение по п.19, в котором доставку осуществляют энтеральным или парентеральным путем введения.

21. Применение растворителя, выбранного из группы, состоящей из N,N-диметилформамида (DMF), N,N-метил-2-пирролидона (NMP), диметилсульфоксида (DMSO), N,N-диметилацетамида (DMAC), диоксана, гексаметилфосфортриамида, пропиленкарбоната, гамма-бутиролактона, монометилового эфира уксусной кислоты, этиллактата, 1,3-диметил-2-имидазолидинона (диметилизосорбид или DMI), изопропилмиристата, рицинолеата пропиленгликоля, изононилизононаноата и эфиров жирных кислот сахарозы, изопропилпальмитата, изопропилизостеарата, диизопропиладипата, диизопропилдимерата, малеинированного соевого масла, октилпальмитата, цетиллактата, глицерина, каприлилгликоля, сквалена, бисаболола, бензилового спирта, цетилрицинолеата, цетилацетата, глицеридов зародышей пшеницы,

миристиллактата, децилолеата, изопропилланолат, пентаэритритилтетрастеарата, дикаприлат/дикапрат неопентилгликоля, изотридецилизонаноата, миристилмиристора, октилдодеканола и октилгидроксистеарата в количестве от около 0,05 до около 30% для повышения растворимости и/или стабильности фосфатного соединения агента передачи электронов, выбранного из группы, состоящей из моно(токоферил)фосфата, моносодиевой соли моно(токоферил)фосфата, дисодиевой соли моно(токоферил)фосфата, ди(токоферил)фосфата, моносодиевой соли ди(токоферил)фосфата.

RU 201213312102 A 7943312102 RU

RU 2012133467 A