



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012144776/15, 31.01.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

21.04.2010 US 12/799,283;

24.05.2010 US 12/800,848

(43) Дата публикации заявки: 27.05.2014 Бюл. № 15

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 21.11.2012

(86) Заявка РСТ:

US 2011/000183 (31.01.2011)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2011/133198 (27.10.2011)

Адрес для переписки:

191036, Санкт-Петербург, а/я 24, "НЕВИНПАТ"

(71) Заявитель(и):

**НАНОМЕГА МЕДИКАЛ КОРПОРЕЙШН  
(US)**

(72) Автор(ы):

**ТУ Хошен (US),****СУН Хсин-Вэнь (TW)****(54) ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ НАНОЧАСТИЦ****(57) Формула изобретения**

1. Фармацевтическая композиция наночастиц, указанные наночастицы включают оболочечную часть, в которой преобладает положительно заряженный хитозан, сердцевинную часть, которая включает один отрицательно заряженный субстрат конъюгата PGA-комплексон, где указанный отрицательно заряженный субстрат по меньшей мере частично нейтрализован частью указанного положительно заряженного хитозана в сердцевинной части, по меньшей мере одно биоактивное средство, загруженное в указанные наночастицы, и необязательно соединение с нулевым зарядом.

2. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы имеют средний размер частиц от приблизительно 50 до 400 нм.

3. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанный хитозан представляет собой N-триметилхитозан, EDTA-хитозан, низкомолекулярный хитозан, производные хитозана или их комбинации.

4. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы образованы посредством простого и умеренного способа ионного желирования.

5. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы составлены в таблетку, пилюлю или конфигурацию жевательной массы.

6. Фармацевтическая композиция по п.5, где указанная таблетка или пилюля покрыты кишечнорастворимым покрытием.

7. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы

инкапсулированы в капсулу.

8. Фармацевтическая композиция по п.7, где указанная капсула дополнительно включает фармацевтически приемлемый носитель, разбавитель или наполнитель.

9. Фармацевтическая композиция по п.7, где указанная капсула дополнительно включает по меньшей мере солилизатор, барботирующее средство или эмульгатор.

10. Фармацевтическая композиция по п.7, где указанная капсула покрыта кишечнорастворимым покрытием.

11. Фармацевтическая композиция по п.7, где указанная капсула дополнительно включает по меньшей мере один усилитель для проникновения.

12. Фармацевтическая композиция по п.11, где указанный усилитель для проникновения выбран из группы, состоящей из хелаторов, желчных солей, анионных поверхностно-активных веществ, жирных кислот средней длины цепи, фосфатных сложных эфиров, хитозана и производных хитозана.

13. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанный комплексон выбран из группы, состоящей из ДТРА (диэтилептираминопентауксусная кислота), EDTA (этилендиаминтетраацетат), IDA (иминодиуксусная кислота), NTA (нитрилотриуксусная кислота), EGTA (этиленгликольтетрауксусная кислота), ВАРТА (1,2-бис(о-аминофеноксид)этан-N,N,N',N'-тетрауксусная кислота), DOTA (1,4,7,10-тетраазамаклододекан-N,N',N,N'-тетрауксусная кислота) и NOTA (2,2',2''-(1,4,7-триазонан-1,4,7-триил) триуксусная кислота).

14. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанное по меньшей мере одно биологически активное средство выбрано из группы, состоящей из белка, пептидов, инсулина, аналога инсулина, GLP-1, аналога GLP-1, сенсibiliзатора инсулина, стимулятора секреции инсулина, GLP-2, аналога GLP-2, ингибитора дипептидилпептидазы 4 (ингибитора DPP-4), экзенатида, лираглутида, албиглутида, таспоглутида, ингибиторов альфа-глюкозидазы, аналога амилина, ингибиторов натрий-глюкозы ко-транспортера типа 2 (SGLT2), бенфлюорекса и толрестата.

15. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы высушены сублимацией, таким образом указанные наночастицы находятся в порошкообразной форме.

16. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы смешаны с трегалозой и затем высушены сублимацией, таким образом указанные наночастицы находятся в порошкообразной форме.

17. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы дополнительно содержат цинк, сульфат магния или триполифосфат натрия (TPP).

18. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы покрыты кишечнорастворимым покрытием.

19. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанный PGA в конъюгате PGA-комплексона представляет собой  $\gamma$ -PGA,  $\alpha$ -PGA, производные PGA или соли PGA.

20. Фармацевтическая композиция по п.1, где указанные наночастицы дополнительно включают по меньшей мере один усилитель для проникновения.