

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2018113280, 16.09.2016

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
16.09.2015 US 62/219,453

(43) Дата публикации заявки: 16.10.2019 Бюл. № 29

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 16.04.2018(86) Заявка РСТ:  
US 2016/052133 (16.09.2016)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2017/049083 (23.03.2017)Адрес для переписки:  
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, строение 3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры"(71) Заявитель(и):  
ДиЭфБи СОРИА, ЭлЭлСи (US)(72) Автор(ы):  
ДЖОНСОН Кит (US),  
ЛЭТРОП Роберт (US),  
ЯН Мэйдун (US),  
МОЛХАРДТ Холли (US),  
ФРАНКЕ Роланд (CA)(54) ДОСТАВКА НАНОЧАСТИЦ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА И СПОСОБЫ ИХ  
ИСПОЛЬЗОВАНИЯ

## (57) Формула изобретения

1. Способ усиления проникновения наночастиц лекарственного средства в кожу, способ включает нанесение на поверхность кожи гидрофобной композиции, содержащей непрерывный гидрофобный носитель, 5-24% масс./масс. одного или нескольких летучих силиконовых текучих веществ и множество наночастиц лекарственного средства, где средний размер частицы (числовой) наночастиц лекарственного средства составляет от 0,1 мкм до 1,5 мкм, где композиция не содержит C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> алифатические спирты и где наночастицы лекарственного средства представляют собой наночастицы таксана.
2. Способ по п. 1, в котором летучее силиконовое текучее вещество представляет собой циклометикон.
3. Способ по п. 2, в котором циклометикон представляет собой циклопентасилоксан.
4. Способ по п. 1, в котором гидрофобный носитель содержит углеводород.
5. Способ по п. 4, в котором углеводород представляет собой вазелин, минеральное масло или твердый парафин или их смеси.
6. Способ по п.1, в котором наночастицы таксана представляют собой наночастицы паклитаксела, наночастицы доцетаксела или наночастицы кабазитаксела.
7. Способ по п.6, в котором наночастицы таксана представляют собой наночастицы

A  
2018113280AR U  
2018113280 A

R U 2 0 1 8 1 1 3 2 8 0 ▾

паклитаксела.

8. Способ по п.7, в котором наночастицы паклитаксела имеют удельную площадь поверхности (SSA) по меньшей мере 18 м<sup>2</sup>/г.

9. Способ по п.1, в котором композиция представляет собой полутвердую композицию.

10. Способ по п.9, в котором полутвердая композиция представляет собой мазь.

11. Способ по п.9, в котором вязкость композиции составляет от 25000 спз до 500000 спз, как измеряют с использованием вискозиметра Brookfield RV на стойке Helipath со включенным Helipath, со шпинделем Т-Е на 10 об./мин при комнатной температуре в течение 45 секунд.

12. Способ по п. 1, в котором гидрофобная композиция состоит по существу из непрерывного гидрофобного носителя, 5-24% масс./масс. одного или нескольких летучих силиконовых текущих веществ и множества наночастиц лекарственного средства,

где летучее силиконовое текущее вещество представляет собой циклопентасилоксан, где непрерывный гидрофобный носитель является нелетучим и неполярным, составляет больше чем 50% масс./масс. композиции и состоит по существу из вазелина, тяжелого минерального масла и твердого парафина, и

где композиция представляет собой безводную полутвердую мазь.

13. Способ по п. 12, в котором помимо циклопентасилоксана, гидрофобная композиция не содержит ни дополнительный усилитель проникновения через кожу, ни дополнительный летучий растворитель; и

гидрофобная композиция не содержит поверхностно-активное средство.

14. Способ по п. 12, в котором наночастицы лекарственного средства представляют собой наночастицы паклитаксела, где наночастицы паклитаксела присутствуют в концентрации от 0,1 приблизительно до 5% масс./масс. и где композиция не содержит белок или альбумин.

15. Гидрофобная композиция, содержащая непрерывный гидрофобный носитель, 5-24% масс./масс. одного или нескольких летучих силиконовых текущих веществ и множество наночастиц лекарственного средства,

где средний размер частицы (числовой) наночастиц лекарственного средства составляет от 0,1 мкм до 1,5 мкм,

где композиция не содержит C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> алифатические спирты, и

где наночастицы лекарственного средства представляют собой наночастицы таксана.

16. Композиция по п. 15, в которой летучее силиконовое текущее вещество представляет собой циклометикон.

17. Композиция по п. 16, в которой циклометикон представляет собой циклопентасилоксан.

18. Композиция по п. 15, в которой гидрофобный носитель содержит углеводород.

19. Композиция по п. 18, в которой углеводород представляет собой вазелин, минеральное масло или твердый парафин; или их смеси.

20. Композиция по п. 15, в которой наночастицы таксана представляют собой наночастицы паклитаксела, наночастицы доцетаксела или наночастицы кабазитаксела.

21. Композиция по п. 15, в которой наночастицы таксана представляют собой наночастицы паклитаксела.

22. Композиция по п. 21, в которой наночастицы паклитаксела имеют удельную площадь поверхности (SSA) по меньшей мере 18 м<sup>2</sup>/г.

23. Композиция по п. 15, где композиция представляет собой полутвердую композицию.

24. Композиция по п. 23, где полутвердая композиция представляет собой мазь.

25. Композиция по п. 23, где вязкость композиции составляет от 25000 спз до 500000 спз, как измеряют с использованием вискозиметра Brookfield RV на стойке Helipath со включенным Helipath, со шпинделем Т-Е на 10 об./мин при комнатной температуре в течение 45 секунд.

26. Гидрофобная композиция по п. 15, состоящая по существу из непрерывного гидрофобного носителя, 5-24% масс./масс. одного или нескольких летучих силиконовых текучих веществ и множества наночастиц лекарственного средства,

где летучее силиконовое текучее вещество представляет собой циклопентасилоксан,

где непрерывный гидрофобный носитель является нелетучим и неполярным, составляет больше чем 50% масс./масс. композиции и состоит по существу из вазелина, тяжелого минерального масла и твердого парафина, и

где композиция представляет собой безводную полутвердую мазь.

27. Гидрофобная композиция по п. 26, где

помимо циклопентасилоксана, гидрофобная композиция не содержит ни дополнительный усилитель проникновения через кожу, ни дополнительный летучий растворитель; и

гидрофобная композиция не содержит поверхностно-активное средство.

28. Композиция по п. 26, в которой наночастицы лекарственного средства представляют собой наночастицы паклитаксела, где наночастицы паклитаксела присутствуют в концентрации от 0,1 приблизительно до 5% масс./масс. и где композиция не содержит белок или альбумин.

29. Композиция по п. 15, в которой наночастицы таксана присутствуют в концентрации от 0,1 до 5% масс./масс.

30. Способ по п. 1, в котором наночастицы таксана присутствуют в концентрации от 0,1 до 5% масс./масс.