

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2012145278/15, 23.03.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
25.03.2010 IE 2010/0174

(43) Дата публикации заявки: 27.04.2014 Бюл. № 12

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 25.10.2012(86) Заявка РСТ:  
IE 2011/000019 (23.03.2011)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2011/117851 (29.09.2011)Адрес для переписки:  
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3, ООО  
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры"

(71) Заявитель(и):

ИПСЕН МЭНЬЮФЭКЧЕРИНГ  
АЙЭЛЭНД ЛИМИТЕД (IE),  
ДЗЕ ПРОВЕСТ, ФЕЛЛОУЗ ЭНД  
СКОЛАРЗ ОФ ДЗЕ КОЛЛЕДЖ ОФ ДЗЕ  
ХОЛИ ЭНД АНДИВАЙДЕД ТРИНИТИ  
ОФ КВИН ЭЛИЗАБЕТ НИАР ДУБЛИН  
(IE)

(72) Автор(ы):

ДИЗИ Патрик Бернард (IE),  
ЛАФМАН Томас Сиаран (IE)

A

## (54) ТРАНСДЕРМАЛЬНОЕ ВВЕДЕНИЕ ПЕПТИДОВ

## (57) Формула изобретения

1. Соль жирной кислоты пептида, где указанная соль жирной кислоты пептида является солью аналога рецептора соматостатина типа-1, типа-2, типа-3, типа-4 или типа-5 или любой их комбинации.

2. Соль жирной кислоты пептида по п.1, где указанный аналог соматостатина является селективным агонистом рецептора соматостатина типа-2.

3. Соль жирной кислоты пептида по п.1, где указанный аналог соматостатина является агонистом рецептора соматостатина типа-2, выбранным из группы, состоящей из:

D-2-Nal-c(Cys-Tyr-D-Trp-Lys-Val-Cys)-Thr-NH<sub>2</sub>;

D-Phe-c(Cys-Phe-D-Trp-Lys-Thr-Cys)-Thr-ола;

[4-(2-гидроксиэтил)]-1-пiperазинилацетил-D-Phe-c(Cys-Tyr-D-Trp-Lys-Abu-Cys)-Thr-NH<sub>2</sub>;

c(Tic-Tyr-D-Trp-Lys-Abu-Phe);

4-(2-гидроксиэтил)-1-пiperазин-2-этансульфонил-D-Phe-c(Cys-Tyr-D-Trp-Lys-Abu-Cys)-Thr-NH<sub>2</sub>;

[4-(2-гидроксиэтил)]-1-пiperазинилацетил-D-Phe-c(Cys-Tyr-D-Trp-Lys-Abu-Cys)-Thr-NH<sub>2</sub>;

D-6-пропил-8бета-эрголинилметилтиоацетил-D-Lys(D-6-пропил-8бета-эрголинилметилтилацетил)-c(Cys-Tyr-D-Trp-Lys-Abu-Cys)-Thr-NH<sub>2</sub>;

D-6-пропил-8бета-эрголинилметилтиоацетил-D-Lys(D-6-пропил-8бета-

R U 2 0 1 2 1 4 5 2 7 8

A  
5 2 7 8  
4 5 2 1 4 2 1 2 0 1 2  
R U

D-Cpa-c(Cys-Tyr-D-Trp-Lys-Val-Cys)-Thr-NH<sub>2</sub>;  
D-Phe-Cpa-Tyr-D-Trp-Lys-Val-Phe-Thr-NH<sub>2</sub>;  
D-Phe-Cpa-Tyr-D-Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-NH<sub>2</sub> и  
Ac-c(Cys-Lys-Asn-Cpa-Phe-D-Trp-Lys-Thr-Phe-Thr-Ser-D-Cys)-NH<sub>2</sub>.

4. Соль жирной кислоты пептида по п.3, где указанный агонист рецептора соматостатина типа-2 является диолеатной солью жирной кислоты:

D-2-Nal-c(Cys-Tyr-D-Trp-Lys-Val-Cys)-Thr-NH<sub>2</sub>;  
D-Phe-c(Cys-Phe-D-Trp-Lys-Thr-Cys)-Thr-ола или  
[4-(2-гидроксиэтил)]-1-пиперазинилацетил-D-Phe-c(Cys-Tyr-D-Trp-Lys-Abu-Cys)-Thr-NH<sub>2</sub>.

5. Соль жирной кислоты пептида по любому из пп. 1-3, где указанная жирная кислота выбрана из группы, состоящей из октановой кислоты, nonановой кислоты, декановой кислоты, додекановой кислоты, тетрадекановой кислоты, цис-9-октадекановой кислоты и цис,цис-9,12-октадекановой кислоты.

6. Соль жирной кислоты пептида по п. 5, где указанная жирная кислота является цис-9-октадекановой кислотой.

7. Композиция для трансдермальной доставки, содержащая соль жирной кислоты пептида по любому из пп. 1-6.

8. Композиция по п.7, дополнительно содержащая химический усилитель проникновения.

9. Композиция по п.8, где указанный химический усилитель проникновения выбран из группы, состоящей из диметилсульфоксида, диметилформамида, диметилацетамида, деканола, додеканола, олеиновой кислоты, 1,8-цинеола, пропиленгликоля и лаурилсульфата натрия.

10. Устройство трансдермальной доставки для трансдермальной доставки соли жирной кислоты пептида по любому из пп. 1-6.

11. Способ изменения биодоступности пептида, предусматривающий увеличение липофильности указанного пептида, где указанное увеличение предусматривает получение соли жирной кислоты указанного пептида по любому из пп. 1-6.