



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ(21), (22) Заявка: **2009113557/15, 07.09.2007**(30) Конвенционный приоритет:
12.09.2006 IT MI2006A001741
15.06.2007 IT MI2007A001205(43) Дата публикации заявки: **20.10.2010** Бюл. № 29(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: **13.04.2009**(86) Заявка РСТ:
EP 2007/059378 (07.09.2007)(87) Публикация РСТ:
WO 2008/031770 (20.03.2008)Адрес для переписки:
**129090, Москва, ул.Б.Спаская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. А.В.Мицу, рег.№ 364**(71) Заявитель(и):
КОСМО ТЕКНОЛОДЖИЗ ЛТД (IE)(72) Автор(ы):
**АЯНИ Мауро (IT),
МОРО Луиджи (IT),
ВИЛЛА Роберто (IT)****(54) ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ ДЛЯ ПЕРОРАЛЬНОГО ИЛИ РЕКТАЛЬНОГО
ВВЕДЕНИЯ БЕЛКОВЫХ ВЕЩЕСТВ****(57) Формула изобретения**

1. Фармацевтическая композиция для перорального или ректального введения активных агентов, отличающаяся тем, что указанные активные агенты представляют собой вещества белковой или пептидной природы, которые действуют как агонисты и/или антагонисты цитокинов и/или интерлейкинов и/или факторов роста и/или интерферонов и/или факторов некроза опухолей, и что указанные вещества изготавливаются в форме таблеток, капсул, гранул, шариков, клизм, суппозиториев, пен, или порошков с добавлением вспомогательных веществ, чтобы гарантировать высвобождение активного агента в кишечнике, предпочтительно в толстой кишке или прямой кишке.

2. Композиция по п.1, отличающаяся тем, что указанные вещества адаптированы для локального действия на уровне кишечника, путем блокирования рецепторов, специфичных для указанных веществ, или путем прямого взаимодействия с циркулирующими цитокинами и ограничения их доступности для рецепторов в тканях кишечника.

3. Композиция по п.1, отличающаяся тем, что указанные активные агенты представляют собой пептидные или белковые вещества, которые были специально

выделены или синтезированы для блокирования или уменьшения активности TNF α в отношении клеток тканей кишечника.

4. Композиция по п.1, отличающаяся тем, что указанные активные агенты принадлежат к химическому классу специфичных моноклональных антител и/или поликлональных антител и/или растворимых рецепторов для цитокинов, в частности, для TNF α и TNF β , и/или частей антитела, содержащих по меньшей мере одну часть последовательности варибельной области иммуноглобулиновой «шапки», способную связываться с TNF α и TNF β , и/или частей последовательности клеточного рецептора для TNF α и TNF β и/или аналогичных структур указанных варибельных областей анти-TNF α и анти-TNF β антител.

5. Композиция по п.1, отличающаяся тем, что указанные активные агенты, частично или полностью, имеют мышиную, химерную или человеческую природу.

6. Композиция по п.1, отличающаяся тем, что фармацевтическая лекарственная форма представляет собой таблетки или капсулы с контролируемым высвобождением и защищенные от среды желудка, содержащие мини-матрицы или гранулы с модифицированным высвобождением и защищенные от среды желудка.

7. Композиции по п.1, отличающаяся тем, что фармацевтическая лекарственная форма представляет собой мультиматричные гранулы или таблетки, в которых по меньшей мере гидрофильная матрица и липофильная и/или амфифильная матрица присутствуют одновременно.

8. Мультиматричная твердая композиция для перорального введения с последующим высвобождением в кишечнике одного или более моноклональных или поликлональных антител или растворимых рецепторов, обладающих специфичными блокирующими функциями в отношении избытка циркулирующих цитокинов и/или TNF для клеток кишечника, предназначенная для лечения патологических состояний аутоиммунной, воспалительной или опухолевой природы, таких как язвенный колит, болезнь Крона, глютеновая болезнь или колоректальный рак.

9. Композиция по п.8, отличающаяся тем, что активный агент состоит из ассоциации моноклональных или поликлональных антител или из растворимых рецепторов TNF в ассоциации с другими активными агентами, обладающими иммуномоделирующим или противовоспалительным, или химиотерапевтическим действием.

10. Применение веществ белковой или пептидной природы, которые действуют как агонисты и/или антагонисты цитокинов и/или интерлейкинов и/или факторов роста и/или интерферонов и/или факторов некроза опухолей, для изготовления лекарственного средства для локализованного местного лечения воспалительных состояний прямой кишки или толстой кишки.

11. Применение по п.10, в котором указанные воспалительные состояния выбраны из язвенного колита, болезни Крона, глютеновой болезни и опухолей кишечника.

12. Применение по п.10, в котором указанное лекарственное средство имеет форму таблетки, капсулы, гранулы или шарика.

13. Применение по п.10, в котором указанное лекарственное средство имеет форму клизмы, пены, суппозитория или порошка.