



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: **2011126176/15, 27.11.2009**

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
**27.11.2008 DK PA200801674**

(43) Дата публикации заявки: **10.01.2013** Бюл. № 1

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: **27.06.2011**

(86) Заявка РСТ:  
**EP 2009/008496 (27.11.2009)**

(87) Публикация заявки РСТ:  
**WO 2010/060644 (03.06.2010)**

Адрес для переписки:  
**129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр.3,  
ООО "Юридическая фирма Городиский и  
Партнеры"**

(71) Заявитель(и):  
**ЛИДДС АБ (SE)**

(72) Автор(ы):  
**АКСЕН Никлас (SE),  
ЛЕННЕРНЕС Ханс (SE),  
МАЛЬМСТЕН Ларс Оке (SE),  
КАРЛССОН Андерс (SE)**

**(54) ПРИМЕНЕНИЕ КАРБОКСИМЕТИЛЦЕЛЛЮЛОЗЫ ДЛЯ КОНТРОЛЯ  
ВЫДАВЛИВАЕМОСТИ И ВРЕМЕНИ ЗАТВЕРЖДЕНИЯ КОМПОЗИЦИЙ, СОДЕРЖАЩИХ  
ОДИН ИЛИ БОЛЕЕ КЕРАМИЧЕСКИХ МАТЕРИАЛОВ**

(57) Формула изобретения

1. Набор, содержащий
  - i) первый компонент, содержащий
    - (a) гемигидрат сульфата кальция ( $\text{CaSO}_4$ ),
    - (b) спрессованные частицы дигидрата сульфата кальция, дополнительно содержащие одно или более терапевтически, профилактически и/или диагностически активных веществ, и
  - ii) второй компонент, содержащий
    - (c) натрий-карбоксиметилцеллюлозу (Na-CMC) и водную среду, включая воду, где соотношение R натрий-карбоксиметилцеллюлозы к сульфату кальция в наборе составляет от 0,1 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г сульфата кальция до 8 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г сульфата кальция.
2. Набор по п.1, где соотношение составляет от 0,5 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г гемигидрата сульфата кальция до 3 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г гемигидрата сульфата кальция.

3. Набор по п.1, где соотношение R составляет от 1 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г гемигидрата сульфата кальция до 3 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г гемигидрата сульфата кальция.

4. Набор по любому из пп.1-3, где карбоксиметилцеллюлоза во втором компоненте растворена в воде.

5. Набор по п.4, где концентрация карбоксиметилцеллюлозы в воде составляет от 0,05% мас./мас. до 1% мас./мас.

6. Набор по п.1, содержащий активное вещество в компоненте i) и/или компоненте ii).

7. Набор по п.6, где активное вещество является антиандрогеном.

8. Набор по п.1, где активное вещество является ципротероном, флутамидом, 2-гидроксифлутамидом или т.п.

9. Набор по п.1, где спрессованные частицы дигидрат сульфата кальция дополнительно содержат активное вещество, например, как определено в п.7 или 8.

10. Набор по п.1, где гемигидрат сульфата кальция компонента i) представлен в смеси с активным веществом.

11. Набор по п.4, где водная среда компонента ii) не содержит уксусную кислоту.

12. Набор по п.1, где указанный гемигидрат сульфата кальция представлен в форме порошка со средним размером гранулы самое большее примерно 75 мкм, таким как, например, самое большее примерно 50 мкм, самое большее примерно 25 мкм, или самое большее примерно 10 мкм.

13. Набор по п.1, где дигидрат сульфата кальция имеет размер частиц от 50 до 600 мкм, такой как, например от 100 до 500 мкм, от 100 до 400 мкм или от 125 до 300 мкм.

14. Набор по п.1, где концентрация названного одного или более активных веществ, если таковые присутствуют, находится в диапазоне от 0,01% мас./мас. до 75% мас./мас., таком как, например, от 0,01% мас./мас. до 50% мас./мас., от 0,01% мас./мас. до 40% мас./мас., от 0,05% мас./мас. до 30% мас./мас., от 0,05% мас./мас. до 20% мас./мас. или от 0,1% мас./мас. до 10% мас./мас., основываясь на общей массе компонента или композиции, в которой присутствует активное вещество.

15. Набор по п.1, где указанная карбоксиметилцеллюлоза имеет степень замещенности от 0,60 до 0,95 производных на мономерную единицу, такую как, например, от 0,80 до 0,95, или от 0,90 до 0,95 производных на мономерную единицу, и/или вязкость от 40 до 7000 mPas, такую как, например, от 500 до 5000 mPas, от 1000 до 4000 mPas или от 2000 до 3000 mPas при 20°C и нормальном давлении.

16. Применение набора по любому из пп.6-15 в медицине.

17. Готовая к применению композиция, полученная путем смешивания компонента i), ii), как определено в любом из пп.1-10.

18. Готовая к применению композиция по п.17, где готовая к применению композиция является выдавливаемой через отверстие шприца, возможно снабженного канюлей, иглой или трубкой.

19. Готовая к применению композиция по п.18, где размер канюли или иглы составляет 15-17G или меньше.

20. Твердая композиция, содержащая

(а) дигидрат сульфата кальция ( $\text{CaSO}_4$ ) и спрессованные частицы дигидрата сульфата кальция,

(б) карбоксиметилцеллюлозу, а именно натрий-карбоксиметилцеллюлозу (Na-CMC), где соотношение R карбоксиметилцеллюлозы к общей массе сульфата кальция (масса гемигидрата сульфата кальция, если таковой присутствует, плюс масса дигидрата сульфата кальция) в композиции составляет от 0,1 мг натрий-

карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г общего сульфата кальция до 8 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г общего сульфата кальция, и

(с) активное вещество, как определено в п.7 или 8.

21. Композиция по п.20, где соотношение составляет от 0,5 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г общего сульфата кальция до 5 мг натрий-карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г общего сульфата кальция.

22. Композиция по п.20 или 21, где соотношение R составляет от 1 мг карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г общего сульфата кальция до 3 мг карбоксиметилцеллюлозы (рассчитанной как Na-CMC)/г общего сульфата кальция.

23. Композиция по п.20, где концентрация названного одного или более активных веществ, если таковые присутствуют, находится в диапазоне от 0,01% мас./мас. до 75% мас./мас., таком как, например, от 0,01% мас./мас. до 50% мас./мас., от 0,01% мас./мас. до 40% мас./мас., от 0,05% мас./мас. до 30% мас./мас., от 0,05% мас./мас. до 20% мас./мас. или от 0,1% мас./мас. до 10% мас./мас., основываясь на общей массе компонента или композиции, в которой присутствует активное вещество.

24. Композиция по п.20, где указанная карбоксиметилцеллюлоза имеет степень замещенности от 0,60 до 0,95 производных на мономерную единицу, такую как, например, от 0,80 до 0,95, или от 0,90 до 0,95 производных на мономерную единицу, и/или вязкость от 40 до 7000 mPas, такую как, например, от 500 до 5000 mPas, от 1000 до 4000 mPas или от 2000 до 3000 mPas при 20°C и нормальном давлении.

25. Способ приготовления готовой к применению композиции, которая определена в п.17 включающий диспергирование смеси из

i) одной или более фракций по размеру гранул гемигидрата сульфата кальция,

ii) одной или более фракций по размеру спрессованных частиц дигидрата сульфата кальция, в

iii) водном растворе, содержащем натрий-карбоксиметилцеллюлозу.

26. Способ по п.25, где i) и/или ii) дополнительно содержит одно или более терапевтически, профилактически и/или диагностически активных веществ.

27. Способ лечения заболеваний или состояний, включающий введение готовой к применению композиции, которая определена в п.17, или композиции, которая определена в любом из пп.20-22, субъекту, нуждающемуся в этом.

28. Способ по п.27, где готовая к применению композиция вводится путем инъекции.

29. Способ по п.28, где инъекция является, например, парентеральной, внутрикожной, подкожной, внутримышечной, внутривенной, внутрикостной и интраперитонеальной или прямой инъекцией в определенный орган/ткань, например, предстательную железу.

30. Способ по п.27, где заболевание или состояние относится к предстательной железе.

31. Способ по п.30, где заболевание является доброкачественной гиперплазией предстательной железы, раком предстательной железы или воспалением предстательной железы.

32. Способ по п.26, где одно или более терапевтически, профилактически и/или диагностически активных веществ выбраны из флутамида, 2-гидроксифлутамида и/или бикалутамида, включая любые их комбинации, и любого другого антиандрогена.

33. Способ по п.27, где фармацевтическая композиция вводится парентерально, включая локальное введение в предстательную железу.