

Title (en)  
ACCUMULATION OF DRUGS INTO LIPOSOMES BY A PROTON GRADIENT.

Title (de)  
ANREICHERUNG VON MEDIKAMENTEN IN LIPOSOMEN MIT HILFE EINES PROTONENGRADIENTEN.

Title (fr)  
ACCUMULATION DE MEDICAMENTS DANS DES LIPOSOMES AU MOYEN D'UN GRADIENT PROTONIQUE.

Publication  
**EP 0472639 A1 19920304 (EN)**

Application  
**EP 90908748 A 19900515**

Priority  
US 35249789 A 19890515

Abstract (en)  
[origin: WO9014105A1] The present invention relates to pharmaceutical compositions and methods of making liposome containing compositions exhibiting characteristics of great uptake. This uptake may be greater than what would be expected by the relationship defined by the Henderson-Hasselbach equation. The present invention also relates to liposomal compositions wherein the liposome comprises in part a membrane-stabilizing component, for example, cholesterol, which exhibits favorable characteristics in preventing rapid release of a pharmaceutical agent selected from the group consisting of quinine, quinidine and diphenhydramine after it has been formulated in liposomes. The present invention also relates to novel liposomal compositions comprising the bronchodilators metaproterenol, isoproterenol and terbutaline. The present invention also relates to minimum buffering capacity required to achieve liposomal encapsulation of pharmaceutical agents with maintenance of a major portion of the initial pH gradient.

Abstract (fr)  
L'invention concerne des compositions pharmaceutiques et des procédés de production de compositions contenant des liposomes et présentant des caractéristiques de grande captation. Cette captation peut être supérieure à celle qu'on l'on suppose en appliquant la relation définie par l'équation de Henderson-Hasselbach. L'invention concerne également des compositions liposomiques dans lesquelles le liposome comprend en partie un composant de stabilisation de la membrane, par exemple du cholestérol, qui présente des caractéristiques favorables de prévention de libération rapide d'un agent pharmaceutique sélectionné dans le groupe comprenant la quinine, la quinidine, et la diphénhydramine après formulation dans les liposomes. L'invention concerne également de nouvelles compositions liposomiques comprenant les bronchodilatateurs, à savoir le métoprotérénol, l'isoprotérénol et la terbutaline. L'invention concerne également une capacité de tampon minimum requise pour obtenir une encapsulation liposomique des agents pharmaceutiques avec maintien d'une grande partie du gradient du pH initial.

IPC 1-7  
**A61K 37/22; A61K 43/00**

IPC 8 full level  
**A61K 9/127** (2006.01); **A61K 31/135** (2006.01); **A61K 31/165** (2006.01); **A61K 31/415** (2006.01); **A61K 31/435** (2006.01); **A61K 31/47** (2006.01); **A61K 31/49** (2006.01); **A61K 31/54** (2006.01); **A61K 31/55** (2006.01); **A61K 45/00** (2006.01); **A61K 47/24** (2006.01)

CPC (source: EP)  
**A61K 9/1278** (2013.01)

Designated contracting state (EPC)  
AT BE CH DE DK ES FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)  
**WO 9014105 A1 19901129**; CA 2056435 A1 19901116; EP 0472639 A1 19920304; EP 0472639 A4 19920701; JP H04505616 A 19921001; MX 9203793 A 19920901

DOCDB simple family (application)  
**US 9002736 W 19900515**; CA 2056435 A 19900515; EP 90908748 A 19900515; JP 50824190 A 19900515; MX 9203793 A 19920629