

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2017123797, 06.07.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
07.07.2016 EP 16382321.4(43) Дата публикации заявки: 09.01.2019 Бюл. №
01

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

ЛАБОРАТОРИОС САЛВАТ, С.А. (ES)

(72) Автор(ы):

ДЕЛЬГАДО ГАНЬЯН, Исабель (ES),
МАРЧАН САНЧО, Сандра (ES),
ИСКИЕРДО ТОРРЕС, Франсиска (ES)

(54) ОФТАЛЬМОЛОГИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ

(57) Формула изобретения

1. Стерильная офтальмологическая композиция, содержащая а) масляную фазу, содержащую касторовое масло и среднецепочечный триглицерид; б) одно или несколько поверхностно-активных веществ; и с) водную фазу, при этом значение pH указанной композиции составляет 5,0-9,0.

2. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что она не содержит ни одного из следующих активных ингредиентов: мезопрам, соталол и циклоспорин А.

3. Композиция по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что массовое соотношение касторового масла и среднецепочечного триглицерида составляет 50:1-1:50, предпочтительно 10:1-1:10, более предпочтительно 1,5:1-1:1,5, более предпочтительно 1:1.

4. Композиция по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что общее количество касторового масла и среднецепочечного триглицерида составляет 0,05-70 мас.% из расчета на общую массу композиции.

5. Композиция по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что среднецепочечный триглицерид представляет собой каприловый/ каприновый триглицерид.

6. Композиция по любому из предшествующих пунктов, дополнительно содержащая одно или несколько масел, за исключением касторового масла и среднецепочечного триглицерида, предпочтительно отличающаяся тем, что одно или несколько масел, за исключением касторового масла и среднецепочечного триглицерида, выбраны из группы, состоящей из этилолеата, изопропилмиристата, изопропилпальмитата, изопропилизостеарата, изостеарилизостеарата, миристиллактата, этилгексилгидроксистеарата, этилгексилпеларгоната, триэтилгексаноина, изогексадекана, минерального масла, растительного масла, в частности, арганового

масла, триизононаноина, C_{12} - C_{15} -алкилбензоата и их смесей.

7. Композиция по любому из предшествующих пунктов, **отличающаяся тем**, что полученное значение гидрофильно-липофильного баланса указанного одного или нескольких поверхностно-активных веществ составляет 10-16, при этом предпочтительно одно или несколько поверхностно-активных веществ выбраны из группы, состоящей из полиоксил 35 касторового масла, полиоксиэтилен 20 сорбитан моноолеата, сорбитанлаурата и их смесей, при этом более предпочтительно указанное поверхностно-активное вещество представляет собой полиоксил 35 касторовое масло.

8. Композиция по любому из предшествующих пунктов, **отличающаяся тем**, что общее количество поверхностно-активного вещества составляет 0,1-40 мас.% из расчета на общую массу композиции.

9. Композиция по любому из предшествующих пунктов, дополнительно содержащая один или несколько регуляторов тоничности, предпочтительно **отличающаяся тем**, что один или несколько регуляторов тоничности выбраны из группы, состоящей из хлорида натрия, глицерина, пропиленгликоля и их смесей.

10. Композиция по любому из предшествующих пунктов, дополнительно содержащая один или несколько регуляторов pH, предпочтительно **отличающаяся тем**, что один или несколько регуляторов pH выбраны из группы, состоящей из трис(гидроксиметил)аминометана, гидрохлорида трис(гидроксиметил)-аминометана, дигидрофосфата калия, гидрофосфата натрия и их смесей.

11. Композиция по любому из предшествующих пунктов, дополнительно содержащая 0,1-10 мас.% одного или нескольких загустителей, выбранных из группы, состоящей из альгината натрия, поливинилпирролидона, желатиновой камеди, хитозана или его производных и их смесей, из расчета на общую массу композиции.

12. Композиция по любому из предшествующих пунктов, дополнительно содержащая один или несколько активных ингредиентов, выбранных из группы, состоящей из экстракта клюквы, экстракта аристотелии чилийской, ретинилацетата, ретинилпальмитата, ретинилпропионата, холекальциферола, эргокальциферола, токоферолацетата и их смесей.

13. Композиция по любому из предшествующих пунктов, **отличающаяся тем**, что указанная композиция содержит, по меньшей мере, 80 мас.% воды из расчета на общую массу композиции.

14. Композиция по любому из предшествующих пунктов в виде наноземulsion.

15. Композиция в соответствии с определением по любому из предшествующих пунктов для медицинского применения.

16. Композиция в соответствии с определением по любому из пп. 1 - 14, для применения при лечении и/или профилактике глазных заболеваний, выбранных из группы, состоящей из следующих заболеваний: сухость глаз (включая сухой кератоконъюнктивит, ксерофтальмия, ксероз и синдром Шегрена), конъюнктивит (включая аллергический конъюнктивит, весенний кератоконъюнктивит, атопический кератоконъюнктивит, пемфигоид, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, вирусный кератоконъюнктивит и лимбальный кератоконъюнктивит), дерматит (включая контактный дерматит, атопический дерматит), блефарит (включая хронический передний блефарит, хронический задний блефарит), энтропион (включая паралимпический энтропион, инволюционный энтропион), синдром болтающегося века, офтальмопатия, вызванная болезнью щитовидной железы, птеригиум, конъюнктивохалазис, повреждения эпителия в результате использования консервантов, повреждения эпителия или передней камеры после офтальмологических операций, недостаток лимбальных клеток, язвы роговицы, вызванные физическими или химическими факторами, кератит (включая стромальный некротический кератит,

синдром Когана, язву Мурена, нейротрофический кератит, кератит, развивающийся при несмыкании глазной щели, инфекционный кристаллический кератит, поверхностный точечный кератит Тайджесона, нитчатый кератит, повторные эрозии эпителия роговицы, дистрофии эпителия и дистрофию Месманна), эписклерит и увеит.

17. Применение стерильной офтальмологической композиции, содержащей а) масляную фазу, содержащую касторовое масло и среднецепочечный триглицерид; б) одно или несколько поверхностно-активных веществ; и с) водную фазу, при этом значение pH указанной композиции составляет 5,0-9,0, для производства лекарственного средства для лечения и/или профилактики заболеваний глаз, выбранных из группы, состоящей из следующих заболеваний: сухость глаз (включая сухой кератоконъюнктивит, ксерофтальмия, ксероз и синдром Шегрена), конъюнктивит (включая аллергический конъюнктивит, весенний кератоконъюнктивит, атопический кератоконъюнктивит, пемфигоид, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, вирусный кератоконъюнктивит и лимбальный кератоконъюнктивит), дерматит (включая контактный дерматит, атопический дерматит), блефарит (включая хронический передний блефарит, хронический задний блефарит), энтропион (включая паралитический энтропион, инволюционный энтропион), синдром болтающегося века, офтальмопатия, вызванная болезнью щитовидной железы, птеригиум, конъюнктивохлазис, повреждения эпителия в результате использования консервантов, повреждения эпителия или передней камеры после офтальмологических операций, недостаток лимбальных клеток, язвы роговицы, вызванные физическими или химическими факторами, кератит (включая стромальный некротический кератит, синдром Когана, язву Мурена, нейротрофический кератит, кератит, развивающийся при несмыкании глазной щели, инфекционный кристаллический кератит, поверхностный точечный кератит Тайджесона, нитчатый кератит, повторные эрозии эпителия роговицы, дистрофии эпителия и дистрофию Месманна), эписклерит и увеит, в частности, для лечения и/или профилактики сухости глаз, блефарита, кератита, например, нитчатого кератита и язвенного кератита, конъюнктивита, включая атопический кератоконъюнктивит, повреждений эпителия в результате использования консервантов, повреждений эпителия или передней камеры после офтальмологических операций, недостатка лимбальных клеток, язв роговицы, вызванных физическими или химическими факторами.

18. Способ профилактики и/или лечения заболеваний глаз, выбранных из группы, состоящей из следующих заболеваний: сухость глаз (включая сухой кератоконъюнктивит, ксерофтальмия, ксероз и синдром Шегрена), конъюнктивит (включая аллергический конъюнктивит, весенний кератоконъюнктивит, атопический кератоконъюнктивит, пемфигоид, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, вирусный кератоконъюнктивит и лимбальный кератоконъюнктивит), дерматит (включая контактный дерматит, атопический дерматит), блефарит (включая хронический передний блефарит, хронический задний блефарит), энтропион (включая паралитический энтропион, инволюционный энтропион), синдром болтающегося века, офтальмопатия, вызванная болезнью щитовидной железы, птеригиум, конъюнктивохлазис, повреждения эпителия в результате использования консервантов, повреждения эпителия или передней камеры после офтальмологических операций, недостаток лимбальных клеток, язвы роговицы, вызванные физическими или химическими факторами, кератит (включая стромальный некротический кератит, синдром Когана, язву Мурена, нейротрофический кератит, кератит, развивающийся при несмыкании глазной щели, инфекционный кристаллический кератит, поверхностный точечный кератит Тайджесона, нитчатый кератит, повторные эрозии эпителия роговицы, дистрофии эпителия и дистрофию Месманна), эписклерит и увеит, в частности, для

лечения и/или профилактики сухости глаз, блефарита, кератита, например, нитчатого кератита и язвенного кератита, конъюнктивита, включая атопический кератоконъюнктивит, повреждений эпителия в результате использования консервантов, повреждений эпителия или передней камеры после офтальмологических операций, недостатка лимбальных клеток, язв роговицы, вызванных физическими или химическими факторами, путем введения нуждающемуся в таком лечении пациенту эффективного количества стерильной офтальмологической композиции, содержащей а) масляную фазу, содержащую касторовое масло и среднецепочечный триглицерид; б) одно или несколько поверхностно-активных веществ; и с) водную фазу, при этом значение рН указанной композиции составляет 5,0-9,0.

RU 2017123797 A

RU 2017123797 A