

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2015103911, 05.07.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
06.07.2012 US 61/668,846

(43) Дата публикации заявки: 27.08.2016 Бюл. № 24

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 06.02.2015(86) Заявка РСТ:
EP 2013/064300 (05.07.2013)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2014/006201 (09.01.2014)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

ЛЕО ФАРМА А/С (DK)

(72) Автор(ы):

ПЕТЕССОН Карстен (DK),
ФРЕДЕРИКСЕН Кит (DK),
ОМКВИСТ Диана (DK),
ЯНССОН Йорген (DK)(54) **КОМПОЗИЦИЯ ДЛЯ МЕСТНОГО ПРИМЕНЕНИЯ, СОДЕРЖАЩАЯ ПЛЕНКООБРАЗУЮЩИЙ ПОЛИМЕР, ДЛЯ ДОСТАВКИ АКТИВНОГО ИНГРЕДИЕНТА НА КОЖУ**

(57) Формула изобретения

1. По существу безводная напыляемая пленкообразующая фармацевтическая композиция для кожного применения, содержащая по меньшей мере один терапевтически активный ингредиент, растворенный в фармацевтически приемлемом пропелленте, выбранном из группы, состоящей из смеси диметилового эфира и второго пропеллента, выбранного из C₃₋₅ алканов, гидрофторалканов, гидрохлоралканов, фторалканов и хлорфторалканов, причем пропеллент присутствует в количестве 50-99,5% мас./мас. композиции, композиция дополнительно содержит пленкообразующий полимер в количестве 0,1-50% мас./мас., пластификатор в количестве 0,1-10% мас./мас., и масляный усиливающий выделение агент в количестве 0,1-15% мас./мас., композиция по существу не содержит низкомолекулярного летучего растворителя.

2. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что пленкообразующий полимер выбирают из группы, состоящей из производных целлюлозы, акриловых полимеров, акриловых сополимеров, метакрилатных полимеров, метакрилатных сополимеров, полиуретанов, поливинилового спирта или его производного, такого как поливинилацетат, силиконовых полимеров и силиконовых сополимеров, или их сополимеров.

3. Композиция по п. 2, отличающаяся тем, что производное целлюлозы выбирают из группы, состоящей из этилцеллюлозы, метилцеллюлозы, гидроксиэтилцеллюлозы,

гидроксипропилцеллюлозы, гидроксипропилметилцеллюлозы.

4. Композиция по п. 2, отличающаяся тем, что акриловый полимер выбирают из группы, состоящей из сополимера метилметакрилата и бутилметакрилата, сополимера этилакрилата и метилметакрилата, сополимера акрилата и метакрилата аммония типа А и типа В, и сополимера акрилатов/октилакриламида.

5. Композиция по любому из пп. 1-4, отличающаяся тем, что пластификатор выбирают из группы, состоящей из триэтилцитрата, трибутилцитрата, ацетилтриэтилцитрата, триацетина, дибутилсебаката и полиэтиленгликоля 100-1000.

6. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что масляный усиливающий высвобождение агент выбирают из группы, состоящей из:

(а) простого эфира полиоксипропилена и жирного алкила;

(б) сложного изопропилового эфира линейной или разветвленной C_{10-18} алкановой или алкеновой кислоты;

(в) сложного моно- или диэфира пропиленгликоля и C_{8-14} жирной кислоты;

(г) линейного или разветвленного C_{8-24} алканол или алкенола;

(д) C_{6-22} ацилглицерида;

(е) N-алкилпирролидона или N-алкилпиперидона;

(ж) минерального масла, такого как жидкий парафин.

7. Композиция по п. 6, отличающаяся тем, что простой эфир полиоксипропилена и жирного алкила выбирают из группы, состоящей из полиоксипропилен-15-стеарилового эфира, полиоксипропилен-11-стеарилового эфира, полиоксипропилен-14-бутилового эфира, полиоксипропилен-10-цетилового эфира или полиоксипропилен-3-миристилового эфира.

8. Композиция по п. 6, отличающаяся тем, что сложный изопропиловый эфир линейной или разветвленной C_{10-18} алкановой или алкеновой кислоты представляет собой изопропилмиристат, изопропилпальмитат, изопропилизостеарат, изопропиллинолеат или изопропилмоноолеат.

9. Композиция по п. 6, отличающаяся тем, что сложный моноэфир пропиленгликоля и C_{8-14} жирной кислоты представляет собой пропиленгликольмонолаурат или пропиленгликольмонокаприлат, и тем, что сложный диэфир пропиленгликоля и C_{8-14} жирной кислоты представляет собой пропиленгликольдипеларгонат.

10. Композиция по п. 6, отличающаяся тем, что линейный C_{8-24} алканол представляет собой каприловый, лауриловый, цетиловый, стеариловый, олеиловый, линолеиловый или миристиловый спирт, или тем, что разветвленный C_{8-24} алканол представляет собой разветвленный C_{18-24} алканол, такой как 2-октилдодеканол.

11. Композиция по п. 6, отличающаяся тем, что C_{6-22} ацилглицерид представляет собой растительное масло, например, кунжутное масло, подсолнечное масло, пальмоядровое масло, кукурузное масло, сафлоровое масло, оливковое масло, масло авокадо, масло жожоба, масло из виноградных косточек, масло канола, масло пшеничных зародышей, миндальное масло, хлопковое масло, арахисовое масло, ореховое масло или соевое масло, растительное масло высокой очистки, например, триглицериды со средней длиной цепи (триглицериды каприловой/каприновой кислот), длинноцепочечные триглицериды, касторовое масло, моноглицерид каприловой кислоты, моно- и диглицериды каприловой/каприновой кислот или моно-, ди- и триглицериды каприловой/каприновой кислот.

12. Композиция по п. 6, отличающаяся тем, что N-алкилпирролидон представляет собой N-метилпирролидон.

13. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что пропеллент представляет собой

диметиловый эфир.

14. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что второй пропеллент представляет собой C_{3-5} алкан, предпочтительно, выбранный из группы, состоящей из н-пропана, изопропана, н-бутана или изобутана.

15. Композиция по п. 14, отличающаяся тем, что C_{3-5} алкан представляет собой н-бутан и/или изобутан.

16. Композиция по п. 15, отличающаяся тем, что соотношение н-бутана и/или изобутана к диметиловому эфиру имеет значение в диапазоне 6:1-0:1 об./об., например, 5:1-1:2, 4:1-1:1, 4:2-1:1, 4:2-4:3 или 4:2-1:1.

17. Композиция по п. 1, дополнительно содержащая антинуклеирующий агент.

18. Композиция по п. 17, отличающаяся тем, что антинуклеирующий агент выбирают из группы, состоящей из поливинилового спирта, гидроксипропилцеллюлозы, гидроксипропилметилцеллюлозы, метилцеллюлозы, поливинилпирролидона и карбоксиметилцеллюлозы.

19. Композиция по п. 1, отличающаяся тем, что терапевтически активный ингредиент выбирают из группы, состоящей из производных или аналогов витамина D, кортикостероидов, ингибиторов фосфодиэстеразы 4, производных ингенола, ретиноидов, таких как адапален, ингибиторов JAK, антагонистов рецептора NK-1, ингибиторов кальциневрина, таких как такролимус или пимекролимус, кератолитических агентов, таких как салициловая кислота или молочная кислота, антибиотиков, таких как фусидовая кислота или клиндамицин, нестероидных противовоспалительных агентов и местных анестетиков, таких как лидокаин.

20. Композиция по п. 19, содержащая кальципотриол или кальципотриола моногидрат в качестве аналога витамина D и бетаметазона дипропионат или валерат в качестве кортикостероида.

21. Аэрозольный контейнер, предназначенный для дозирования композиции для местного применения на пораженный участок кожи, включающий корпус контейнера, содержащий композицию по любому из пп. 1-20, и блок клапана, включающий приводной механизм для высвобождения композиции в виде спрея.

22. Контейнер по п. 21, отличающийся тем, что блок клапана имеет по меньшей мере одно отверстие с диаметром 0,05-1 мм.

23. Контейнер по п. 21, отличающийся тем, что приводной механизм снабжен отверстием с диаметром 0,3-1,5 мм.

24. Композиция по п. 1 для использования при лечении дерматологических заболеваний или состояний.

25. Композиция по п. 24, отличающаяся тем, что дерматологическое заболевание или состояние выбирают из группы, состоящей из псориаза, пустулезного акродерматита, ихтиоза, атопического дерматита, контактного дерматита, экземы, старческого кератоза, прурига, розовых угрей и угревой сыпи.