

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

(21)(22) Заявка: 2017137763, 05.05.2016

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
05.05.2015 US 62/157,257

(43) Дата публикации заявки: 05.06.2019 Бюл. № 16

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 05.12.2017(86) Заявка РСТ:  
US 2016/030912 (05.05.2016)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2016/179357 (10.11.2016)Адрес для переписки:  
190000, Санкт-Петербург, БОКС-1125

(71) Заявитель(и):

**АЙПОИНТ ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ ЮЭС,  
ИНК. (US)**

(72) Автор(ы):

**ЭШТОН, Пол (US)**(54) **ДЕПО-СОСТАВЫ ДЛЯ ИНЪЕКЦИЙ**

## (57) Формула изобретения

1. Композиция для инъекций, содержащая плохо растворимый в воде ингибитор киназы, растворенный в смешивающемся с водой органическом растворителе, при этом:

концентрация ингибитора киназы в композиции составляет по меньшей мере 200 мкг/мл; и

концентрация ингибитора киназы в композиции по меньшей мере в 100 раз выше, чем растворимость ингибитора киназы в воде при 37°C.

2. Композиция для инъекций по п. 1, отличающаяся тем, что концентрация ингибитора киназы в композиции составляет по меньшей мере 800 мкг/мл.

3. Композиция для инъекций по п. 1 или 2, отличающаяся тем, что концентрация ингибитора киназы в композиции по меньшей мере в 200 раз выше, чем растворимость ингибитора киназы в воде при 37°C.

4. Композиция для инъекций по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что растворимость ингибитора киназы в воде составляет менее 10 мкг/мл.

5. Композиция для инъекций по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что органический растворитель представляет собой этанол.

6. Композиция для инъекций по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что ингибитор киназы выбран из бафетиниба, босутиниба, дазатиниба, иматиниба, nilотиниба, понатиниба, радотиниба и SU6656.

7. Композиция для инъекций по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся

тем, что ингибитор киназы выбран из апатиниба, акситиниба, кабозантиниба, цедираниба, креноланиба, форетиниба, ленватиниба, линифаниба, маситиниба, мотезаниба, нинтеданиба, пазопаниба, пегаптаниба, регорафениба, семаксаниба, сорафениба, сунитиниба, тивозаниба, тоцераниба, вандетаниба и ваталаниба.

8. Композиция для инъекций по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что ингибитор киназы представляет собой сорафениб.

9. Композиция для инъекций по п. 8, отличающаяся тем, что: ингибитор киназы представляет собой сорафениб; и концентрация ингибитора киназы составляет от примерно 800 мкг/мл до примерно 4000 мкг/мл.

10. Композиция для инъекций по любому из предшествующих пунктов, отличающаяся тем, что композиция представляет собой жидкость.

11. Флакон, содержащий композицию для инъекций по любому из предшествующих пунктов

12. Флакон по п. 11, содержащий от примерно 50 мкл до примерно 500 мкл композиции для инъекций.

13. Флакон по п. 11 или 12, содержащий от примерно 50 мкг до примерно 1000 мкг сорафениба.

14. Флакон по любому из пп. 11-13, отличающийся тем, что указанный флакон является стеклянным.

15. Шприц, содержащий композицию для инъекций по любому из пп. 1-10.

16. Шприц по п. 15, содержащий от примерно 50 мкл до примерно 500 мкл композиции для инъекций.

17. Шприц по п. 15 или 16, содержащий от примерно 50 мкг до примерно 1000 мкг сорафениба.

18. Шприц по любому из пп. 15-17, отличающийся тем, что указанный шприц имеет объем от примерно 50 мкл до примерно 1 мл.

19. Шприц любому из пп. 15-18, отличающийся тем, что указанный шприц содержит стекло, полипропилен или политетрафторэтилен.

20. Шприц по любому из пп. 15-19, дополнительно содержащий фильтр.

21. Шприц по п. 20, отличающийся тем, что фильтр содержит поры с размером пор от примерно 0,2 мкм до примерно 5 мкм.

22. Шприц по п. 20 или 21, отличающийся тем, что фильтр представляет собой фильтрующую иглу.

23. Шприц по любому из пп. 15-21, дополнительно содержащий иглу.

24. Шприц по п. 23, отличающийся тем, что игла содержит металл, такой как нержавеющая сталь.

25. Шприц по любому из пп. 22-24, отличающийся тем, что указанная игла имеет длину от примерно 0,25 дюйма до примерно 1,0 дюйма.

26. Шприц по п. 25, отличающийся тем, что игла имеет длину примерно 0,5 дюйма.

27. Шприц по любому из пп. 22-26, отличающийся тем, что игла представляет собой иглу от примерно 28 калибра до примерно 33 калибра.

28. Шприц по п. 27, отличающийся тем, что игла представляет собой иглу 29 калибра, 30 калибра, 31 калибра или 32 калибра.

29. Набор, содержащий флакон по любому из пп. 11-14 и шприц.

30. Способ предотвращения или лечения заболевания глаз у субъекта, включающий введение посредством инъекции композиции по любому из пп. 1-10 в стекловидное тело глаза субъекта.

31. Способ п. 30, включающий введение посредством инъекции от примерно 10 мкл до примерно 100 мкл композиции в стекловидное тело глаза.

32. Способ п. 31, включающий введение посредством инъекции примерно 50 мкл композиции в стекловидное тело глаза.

33. Способ по любому из пп. 30-32, включающий фильтрование композиции перед введением композиции в глаз посредством инъекции.

34. Способ по п. 33, отличающийся тем, что фильтрование композиции включает пропускание указанной композиции через фильтрующую иглу.

35. Способ по любому из пп. 30-34, отличающийся тем, что субъект выбран из грызунов, зайцеобразных, овец, свиней, собак, кошек, лошадей, быков и приматов.

36. Способ по п. 35, отличающийся тем, что субъект представляет собой человека.

37. Способ по любому из пп. 30-36, отличающийся тем, что указанный субъект имеет старческую дегенерацию макулы.

38. Способ по любому из пп. 30-37, отличающийся тем, что указанный субъект имеет сухую дегенерацию макулы.

39. Способ по любому из пп. 30-38, отличающийся тем, что указанный субъект имеет сухую старческую дегенерацию макулы.

40. Способ по любому из пп. 30-39, отличающийся тем, что указанный субъект подвержен риску развития сухой старческой дегенерации макулы.

41. Способ по любому из пп. 30-37, отличающийся тем, что указанный субъект имеет влажную дегенерацию макулы.

42. Способ по любому из пп. 37-41, отличающийся тем, что указанный субъект имеет влажную старческую дегенерацию макулы.

43. Способ по любому из пп. 30-42, отличающийся тем, что указанный субъект имеет географическую атрофию или субъект подвержен риску географической атрофии.

44. Способ по любому из пп. 30-43, отличающийся тем, что указанный субъект страдает потерей зрения или субъект подвержен риску развития потери зрения.

45. Способ по любому из пп. 30-44, отличающийся тем, что указанный субъект имеет окклюзию вены сетчатки.

46. Способ по п. 45, отличающийся тем, что указанный субъект имеет неишемическую окклюзию вены сетчатки.

47. Способ по п. 45, отличающийся тем, что указанный субъект имеет ишемическую окклюзию вены сетчатки.