



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2012127675/15, 01.12.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
03.12.2009 US 61/266,368

(43) Дата публикации заявки: 20.01.2014 Бюл. № 2

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 03.07.2012(86) Заявка РСТ:
US 2010/058563 (01.12.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2011/068872 (09.06.2011)

Адрес для переписки:

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

(71) Заявитель(и):

АЛЬКОН РИСЕРЧ, ЛТД. (US)

(72) Автор(ы):

ЧОВХАН Масуд А. (US),
ГХОШ Малай (US),
АСГХАРИАН Бахрам (US),
ХАН Уэсли Вехсин (US)(54) **СУСПЕНЗИИ НАНОЧАСТИЦ, СОДЕРЖАЩИЕ КАРБОКСИВИНИЛОВЫЙ ПОЛИМЕР**

(57) Формула изобретения

1. Офтальмологические композиции суспензии на водной основе для местного применения, содержащие:

карбоксивиниловый полимер в концентрации от 0,1 до 0,5% (вес./об.);

галактоманнан в концентрации от 0,1 до 0,4% (вес./об.);

борат в концентрации от 0,4 до 2,0% (вес./об.); и

умеренно растворимое соединение в виде частиц, причем вышеупомянутое соединение обладает растворимостью в воде при 25°C от 0,001 до 0,1% (вес./об.) и размером частиц от 50 до 700 нм.

2. Композиция по п.1, дополнительно содержащая средство для регулирования pH в количестве, достаточном для того, чтобы композиция имела pH от 5,0 до 7,2.

3. Композиция по п.1, дополнительно содержащая средство для регулирования тоничности в количестве, достаточном, чтобы композиция имела осмолярность от 250 до 350 мОсмоль/кг.

4. Композиция по п.1, в которой вышеуказанные плохо растворимое соединение в виде частиц представляет собой непафенак в концентрации от 0,1 до 1,0% (вес./об.).

5. Композиция по п.1, в которой вышеуказанный карбоксивиниловый полимер представляет собой карбомер в концентрации 0,4% (вес./об.).

6. Композиция по п.1, дополнительно содержащая измельчающее средство в концентрации от 0,005 до 0,1% (вес./об.).

7. Композиция по п.6, в которой вышеуказанное измельчающее средство представляет собой поверхностно-активное вещество или полимер.

8. Композиция по п.7, в которой вышеуказанное измельчающее средство представляет собой натрий карбоксиметилцеллюлозу.

9. Композиция по п.1, дополнительно содержащая средство, регулирующее тоничность, представляющее собой соль хлорида металла.

10. Композиция по п.9, в которой вышеуказанная соль хлорида металла, является хлоридом натрия в концентрации 0,4% (вес./об.).

11. Композиция по п.1, дополнительно содержащая неионное гидроксильное соединение в качестве средства, регулирующего тоничность.

12. Композиция по п.1, дополнительно содержащая как консервант, так и хелатирующий агент.

13. Композиция по п.12, в которой консервант представляет собой хлорид бензалкония в концентрации 0,005% (вес./об.) и хелатирующий агент представляет собой эдетат натрия в концентрации 0,01% (вес./об.).

14. Композиция по п.1, в которой вышеуказанный карбоксивиниловый полимер представляет собой карбомер, вышеуказанный галактоманнан представляет собой гуар, вышеупомянутый борат представляет собой борную кислоту и вышеупомянутое плохо растворимое соединение в виде частиц представляет собой непафенак в концентрации от 0,1 до 1,0% (вес./об.).

15. Композиция по п.14, содержащая 0,4% (вес./об.) карбомера, 0,2% (вес./об.) гуара, 0,5% (вес./об.) борной кислоты и 0,3% (вес./об.) непафенака.

16. Композиция по п.15, в которой вышеупомянутый непафенак обладает средним размером частиц 400 нм.

17. Способ лечения офтальмологических нарушений у пациента, включающий местное введение пациентом композиции по п.1.

18. Способ по п.17, в котором вышеуказанное офтальмологическое нарушение выбирают из группы, состоящей из нарушения поверхности глаза и сетчатки, глаукомы, синдрома сухого глаза, боли поверхности глаза, увеита, склерита, воспаления эписклеральной соединительной ткани (эписклерита), кератита, воспаления, вызванного хирургическим вмешательством, эндофтальмита, воспаления радужной оболочки глаза, атрофической дегенерации желтого пятна, пигментной дистрофии сетчатки, ятрогенной ретинопатии, разрывов и дыр в сетчатке, макулярного отека, цистозного макулярного отека, диабетического макулярного отека, диабетической ретинопатии, серповидно-клеточной ретинопатии, закупорки вен и артерий сетчатки, невротии зрительного нерва, экссудативной макулярной дистрофии, неоваскулярной глаукомы, неоваскуляризации роговицы, (циклита), серповидно-клеточной ретинопатии и птеригия глаза.

19. Офтальмологическая композиция суспензии для местного применения, состоящая по существу из:

- a) 0,3% (вес./об.) непафенака, имеющего размеры частиц от 50 до 700 нм;
- b) 0,4% (вес./об.) карбомера;
- c) 0,2% (вес./об.) гуара;
- d) 0,5% (вес./об.) борной кислоты;
- e) 0,06% (вес./об.) натрий карбоксиметилцеллюлозы;
- f) 0,4% (вес./об.) хлорида натрия;
- g) 0,5% (вес./об.) пропиленгликоля;
- h) средства, регулирующего рН в количестве, достаточном для того чтобы композиция имела рН 7,0;
- i) 0,005% (вес./об.) хлорида бензалкония;

- ж) 0,01% эдетата динатрия; и
- к) очищенной воды.

20. Способ поддержания вязкости наносимой местно офтальмологической композиции, содержащей от 0,1 до 0,5% (вес./об.) карбомера, когда вышеуказанную композицию местно наносят на глаз, включающий:

добавление галактоманнана, достаточного для обеспечения концентрации от 0,1% (вес./об.) до 0,4% (вес./об.) галактоманнана в вышеуказанной композиции, и бората, достаточного для обеспечения концентрации от 0,4% (вес./об.) до 0,6% (вес./об.) в вышеуказанной композиции.

21. Способ по п.20, в котором вышеупомянутая композиция обладает рН от 5,0 до 7,2.

22. Способ по п.20, в котором вышеуказанная композиция дополнительно содержит плохо растворимое соединение в виде частиц.

23. Способ по п.22, в котором вышеуказанное плохо растворимое соединение в виде частиц представляет собой непафенак в концентрации 0,3% (вес./об.).

RU 201212127675 A

RU 201212127675 A