



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ**

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2007137960/14, 14.03.2006

(30) Конвенционный приоритет:  
14.03.2005 US 60/661,661

(43) Дата публикации заявки: 20.04.2009 Бюл. № 11

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную  
фазу: 15.10.2007(86) Заявка РСТ:  
US 2006/008868 (14.03.2006)(87) Публикация РСТ:  
WO 2006/099275 (21.09.2006)Адрес для переписки:  
127055, Москва, а/я 11, пат.пov.  
Н.К.Попеленскому, рег. № 31(71) Заявитель(и):  
**МЕДА АБ (SE)**(72) Автор(ы):  
**ЛИ Джеймс Х. (US),  
ФОКС Терренс Л. (US)**

**(54) СПОСОБ ЛЕЧЕНИЯ АКТИНИЧЕСКОГО КЕРАТОЗА (ВАРИАНТЫ) И  
2-МЕТИЛ-1-(2-МЕТИЛПРОПИЛ)-1Н-ИМИДАЗО[4,5-с][1,5]НАФТИРИДИН-4-АМИН В  
КАЧЕСТВЕ СРЕДСТВА ЛЕЧЕНИЯ АКТИНИЧЕСКОГО КЕРАТОЗА**

**(57) Формула изобретения**

1. Способ лечения актинического кератоза, заключающийся в местном нанесении на область поражения актиническим кератозом дважды в неделю в течение приблизительно 8 недель препарата, содержащего 2-метил-1-(2-метилпропил)-1Н-имидаzo[4,5-с][1,5]нафтиридин-4-амин, в количестве 0,3 мас.% от общего веса препарата.
2. Способ по п.1, в котором 2-метил-1-(2-метилпропил)-1Н-имидаzo[4,5-с][1,5]нафтиридин-4-амин добавляют в препарат в виде соли.
3. Способ по п.1, в котором 2-метил-1-(2-метилпропил)-1Н-имидаzo[4,5-с][1,5]нафтиридин-4-амин добавляют в препарат в виде свободного основания.
4. Способ по п.1, в котором препарат дополнительно содержит консервирующую систему, антиоксидант, хелатирующий агент, жирную кислоту, гидрофобный компонент, увеличитель вязкости, эмульгатор, регулятор pH или их комбинации.
5. Способ по п.4, в котором препарат содержит консервирующую систему.
6. Способ по п.5, в котором консервирующая система включает в себя сорбиновую кислоту, изопропилсорбат, сорбат кальция, сорбат калия, сорбат натрия,

RU 2007137960 A

RU 2007137960 A

триэтаноламинсorbit или их комбинации.

7. Способ по п.4 или 5, в котором консервирующая система включает в себя метилпарабен, этилпарабен, пропилпарабен, бутилпарабен, феноксиэтанол или их комбинации.

8. Способ по п.4 или 5, в котором консервирующая система дополнительно включает солюбилизатор, усиливающий действие консерванта.

9. Способ по п.8, в котором солюбилизатор, усиливающий действие консерванта, выбирается из группы, состоящей из сложногоmonoэтилового эфира диэтилен гликоля, пропиленгликоля, поли(этиленгликоль)-(4)монолаурата и их комбинаций.

10. Способ по п.4 или 5, в котором препарат содержит консервирующую систему, включающую консервант на основе сорбиновой кислоты, который выбирается из группы, состоящей из сорбиновой кислоты, ее сложных эфиров, ее солей и их комбинаций, а также антиоксидант.

11. Способ по п.10, в котором препарат дополнительно содержит жирную кислоту; гидрофобный, непротонный компонент, смешивающийся с жирной кислотой и включающий гидрокарболовую группу из 7 или более атомов углерода, и гидрофильтральный увеличитель вязкости, выбранный из эфиров целлюлозы и карбомеров.

12. Способ по п.4, в котором антиоксидант выбирается из группы, состоящей из аскорбиновой кислоты, аскорбипальмитата, бутилированного гидроксианизола, бутилированного гидрокситолуола, цистеина, пропилгаллата, натрий формальдегидсульфоксилата, тиосульфата натрия, диоксида серы и токоферола и их комбинаций.

13. Способ по п.12, в котором антиоксидант содержит функциональную группу, способную отдавать атом водорода.

14. Способ по п.13, в котором антиоксидант выбирается из группы, состоящей из соединений, содержащих ароматические гидрокси-группы, способные отдавать атом водорода.

15. Способ по п.14, в котором антиоксидант выбирается из группы, состоящей из бутилированного гидроксианизола, бутилированного гидрокситолуола, пропилгаллата, токоферола и их комбинаций.

16. Способ по п.4, в котором препарат дополнительно содержит хелатирующий агент.

17. Способ по п.16, в котором хелатирующий агент выбирается из группы, состоящей из этилендиаминететрауксусной кислоты, лимонной кислоты, их гидратов, их солей, гидратов их солей и их комбинаций.

18. Способ по п.4, в котором препарат дополнительно содержит жирную кислоту, имеющую 6-28 атомов углерода, и гидрофобный непротонный компонент, смешивающийся с жирной кислотой и включающий гидрокарболовую группу из 7 или более атомов углерода.

19. Способ по п.1, в котором препарат содержит консервирующую систему, включающую 0,02-0,2 мас.% консерванта на основе сорбиновой кислоты, который выбирается из группы, состоящей из сорбиновой кислоты, ее сложных эфиров, ее солей и их комбинаций, 0-10,0 мас.% солюбилизатора, усиливающего действие консерванта, и 0,05-0,2 мас.% вторичного консервирующего соединения, при этом препарат содержит 0,001-0,2 мас.% антиоксиданта, включающего функциональную группу, способную отдавать атом водорода; 0-0,1 мас.% хелатирующего агента; 1-30 мас.% жирной кислоты; 1-15 мас.% триглицерида со средней цепью; 0,2-2,0 мас.% увеличителя вязкости; 0,1-6,0 мас.% эмульгатора и воду, причем препарат имеет pH от 4,0 до 6,0, а массовые проценты рассчитываются от общего веса препарата.

20. Способ по п.1, в котором препарат дополнительно содержит 0,02-0,2 мас.%

консерванта на основе сорбиновой кислоты, который выбирается из группы, состоящей из сорбиновой кислоты, ее сложных эфиров, ее солей и их комбинаций; 0-10,0 мас.% пропиленгликоля; 0,05-0,2 мас.% метилпарабена; 0,001-0,2 мас.% бутилированного гидроксианизола, бутилированного гидрокситолуола или их комбинаций; 0-0,1 мас.% этилендиаминтетрауксусной кислоты, ее гидрата, ее соли, гидрата ее соли или их комбинаций; 1-30 мас.% изостеариновой кислоты; 1-15 мас.% триглицерида со средней цепью; 0,2-2,0 мас.% карбомера; 0,1-6,0 мас.% полоксамера и воду; причем препарат имеет pH 4,0-6,0, а массовые проценты рассчитываются от общего веса препарата.

21. Способ лечения актинического кератоза, заключающийся в местном нанесении на область поражения актиническим кератозом два раза в неделю в течение 8 недель препарата, содержащего 0,3 мас.%

2-метил-1-(2-метилпропил)-1Н-имидазо[4,5-с][1,5]нафтиридин-4-амина; 0,15 мас.% сорбиновой кислоты; 5,0 мас.% пропиленгликоля; 0,2 мас.% метилпарабена; 0,1 мас.% бутилированного гидроксианизола; 0,05 мас.% дигидрата динатриевой соли этилендиаминтетрауксусной кислоты;

7,0 мас.% изостеариновой кислоты; 4,0 мас.% каприлового/капринового триглицерида; 1,0 мас.% карбомера; 3,5 мас.% полоксамера; 0,8 мас.% водного раствора, 20 мас.% NaOH в воде и 77,9 мас.% воды; причем массовые проценты рассчитываются от общего веса препарата.

22. Способ лечения актинического кератоза, заключающийся в местном нанесении на область поражения актиническим кератозом два раза в неделю в течение 8 недель препарата, содержащего 0,3 мас.%

2-метил-1-(2-метилпропил)-1Н-имидазо[4,5-с][1,5]-нафтиридин-4-амина; 0,1 мас.% сорбиновой кислоты; 5,0 мас.% пропиленгликоля; 0,2 мас.% метилпарабена; 0,01 мас.% бутилированного гидроксианизола; 0,05 мас.% дигидратадинатриевой соли этилендиаминтетрауксусной кислоты; 7,0 мас.% изостеариновой кислоты; 4,0 мас.% каприлового/капринового триглицерида; 1,0 мас.% карбомера; 3,5 мас.% полоксамера; 0,8 мас.% водного раствора, 20 мас.% NaOH в воде и 78,0 мас.% воды; причем массовые проценты основываются на общей массе препарата.

### 23. Применение

2-метил-1-(2-метилпропил)-1Н-имидазо[4,5-с][1,5]-нафтиридин-4-амина для приготовления препарата для лечения актинического кератоза путем нанесения препарата местно на область поражения актиническим кератозом дважды в неделю в течение приблизительно 8 недель.

### 24. Применение по п.23, в котором количество

2-метил-1-(2-метилпропил)-1Н-имидазо[4,5-с][1,5] нафтиридин-4-амина составляет 0,3 мас.% от общего веса препарата.