



(51) МПК
A61K 31/335 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61P 27/14 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
 ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ**

(21)(22) Заявка: 2013140423, 18.05.2012

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
 18.05.2012

Дата регистрации:
 21.03.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
 19.05.2011 US 61/487,789;
 19.10.2011 US 61/548,957

(43) Дата публикации заявки: 10.03.2015 Бюл. № 7

(45) Опубликовано: 21.03.2017 Бюл. № 9

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
 национальной фазе: 30.08.2013

(86) Заявка РСТ:
 US 2012/038663 (18.05.2012)

(87) Публикация заявки РСТ:
 WO 2012/159064 (22.11.2012)

Адрес для переписки:
 129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
 ООО "Юридическая фирма Городисский и
 Партнеры"

(72) Автор(ы):

ГАМАЧ Дэниел А. (US),
АЛАНИ Ламан (US),
ГХОШ Малай (US),
ГАЛАН Франсиско Хавьер (ES),
ПЕРДИГЭР Нурия (ES),
СИНГХ Онкар (US)

(73) Патентообладатель(и):

АЛЬКОН РИСЕРЧ, ЛТД. (US)

(56) Список документов, цитированных в отчете
 о поиске: WO 2009003199 A1, 31.12.2008. US
 2005158387 A1, 21.07.2001. WO 2008015695
 A2, 07.02.2008. WO 9639147 A2, 12.12.1996.
 WO 0154687 A1, 02.08.2001.

(54) **ОФТАЛЬМОЛОГИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ С ВЫСОКОЙ КОНЦЕНТРАЦИЕЙ
 ОЛОПАТАДИНА**

(57) **Формула изобретения**

1. Офтальмологическая композиция для лечения аллергического конъюнктивита
 глаз, содержащая:

по меньшей мере 0,67% масс./об., но не больше чем 1,0% масс./об. олопатадина,
 который растворен в растворе, и

где композиция помещена в глазной капельный дозатор для местного нанесения
 композиции в глаз в виде капель, которые имеют размер капли по меньшей мере 18
 мкл, но не больше чем 45 мкл, и где композиция имеет рН от 5,5 до 8,0.

2. Композиция по п. 1, в которой концентрация олопатадина составляет по меньшей
 мере 0,7% масс./об..

3. Композиция по п. 1, дополнительно содержащая производное γ -циклодекстрина,
 производное β -циклодекстрина или оба производных для обеспечения растворимости

олопатадина.

4. Композиция по п. 1, дополнительно содержащая полимер лактама для обеспечения растворимости олопатадина.

5. Композиция по п. 4, в которой полимер лактама представляет собой поливинилпирролидон.

6. Композиция по любому из пп. 1-3, дополнительно содержащая полиэфир.

7. Композиция по п. 6, в которой полиэфир представляет собой полиэтиленгликоль.

8. Композиция по любому из пп. 1-3, которая имеет осмоляльность от 200 до 450.

9. Офтальмологическая композиция для лечения аллергического конъюнктивита глаз, содержащая:

по меньшей мере 0,67% масс./об., но не больше чем 1,0% масс./об. олопатадина, растворенного в растворе;

полиэтиленгликоль, имеющий молекулярную массу от 300 до 500;

поливинилпирролидон; и

производное циклодекстрина, выбранное из производного β -циклодекстрина, γ -циклодекстрина или обоих производных,

где композиция помещена в глазной капельный дозатор для местного нанесения композиции в глаз в виде капель, которые имеют размер капли по меньшей мере 18 мкл, но не больше чем 45 мкл, и где композиция имеет рН 5,5-8,0.

10. Композиция по п. 9, дополнительно содержащая консервант, выбранный из полимерного соединения четвертичного аммония и бензалконийхлорида.

11. Композиция по п. 10, в которой производное циклодекстрина представляет собой гидроксипропил- β -циклодекстрин или простой сульфоалкиловый эфир β -циклодекстрина.

12. Композиция по п. 11, в которой β -производное циклодекстрина представляет собой гидроксипропил- β -циклодекстрин, если консервантом является бензалконийхлорид, и производное β -циклодекстрина представляет собой простой сульфоалкиловый эфир β -циклодекстрина, если консервантом является полимерное соединение четвертичного аммония.

13. Композиция по п. 10, в которой консервант представляет собой бензалконийхлорид, и производное циклодекстрина представляет собой гидроксипропил- γ -циклодекстрин.

14. Композиция по любому из пп. 9-13, дополнительно содержащая борат.

15. Композиция по п. 14, дополнительно содержащая полиол.

16. Офтальмологическая композиция для лечения аллергического конъюнктивита глаз, содержащая:

по меньшей мере 0,67% масс./об., но не больше чем 1,0% масс./об. олопатадина, растворенного в растворе;

полиэтиленгликоль, имеющий молекулярную массу от 300 до 500, где концентрация полиэтиленгликоля в растворе составляет от приблизительно 2,0% масс./об. до приблизительно 6,0% масс./об.;

полимер лактама, где полимер лактама представляет собой поливинилпирролидон, и концентрация поливинилпирролидона в растворе составляет от приблизительно 2,0% масс./об. до приблизительно 6,0% масс./об.; и

производное β -циклодекстрина или производное γ -циклодекстрина, выбранное из простого сульфоалкилового эфира β -циклодекстрина, гидроксипропил- γ -циклодекстрина и гидроксипропил- β -циклодекстрина, где концентрация производного β -циклодекстрина или производного γ -циклодекстрина составляет по меньшей мере 0,5% масс./об., но не больше чем 2,0% масс./об.,

где композиция помещена в глазной капельный дозатор для местного нанесения композиции в глаз в виде капель, которые имеют размер капли по меньшей мере 18

мкл, но не больше чем 45 мкл, и где композиция имеет рН 5,5-8,0.

17. Композиция по п. 16, дополнительно содержащая борат в концентрации по меньшей мере приблизительно 0,18% масс./об., но менее чем приблизительно 0,5% масс./об.

18. Композиция по п. 17, дополнительно содержащая полиол.

19. Композиция по п. 18, где полиол включает полиэтиленгликоль в концентрации по меньшей мере 0,4% масс./об., но не больше, чем 2,2% масс./об.

20. Офтальмологическая композиция для лечения аллергического конъюнктивита глаз, содержащая:

по меньшей мере 0,67% масс./об., но не больше чем 1,0% масс./об. олопатадина, растворенного в растворе;

полиэтиленгликоль, имеющий молекулярную массу от 300 до 500, где концентрация полиэтиленгликоля в растворе составляет от приблизительно 2,0% масс./об. до приблизительно 6,0% масс./об.;

полимер лактама, где полимер лактама представляет собой поливинилпирролидон, и концентрация поливинилпирролидона в растворе составляет от приблизительно 2,0% масс./об. до приблизительно 6,0% масс./об.; и

гидроксипропил- γ -циклодекстрин в композиции в концентрации по меньшей мере 0,5% масс./об., но не больше чем 2,0% масс./об.,

где композиция помещена в глазной капельный дозатор для местного нанесения композиции в глаз в виде капель, которые имеют размер капли по меньшей мере 18 мкл, но не больше чем 45 мкл, и где композиция имеет рН 5,5-8,0.

21. Композиция по п. 20, дополнительно содержащая борат в концентрации по меньшей мере приблизительно 0,18% масс./об., но менее чем приблизительно 0,5% масс./об.

22. Композиция по п. 21, дополнительно содержащая полиол.

23. Композиция по п. 22, в которой полиол включает полиэтиленгликоль в концентрации по меньшей мере 0,4% масс./об., но не больше чем 2,2% масс./об.

24. Способ лечения симптомов аллергии глаз, включающий:

местное нанесение офтальмологической композиции по любому из пп. 1-23 в глаз человека.

25. Способ по п. 24, в котором стадия местного применения композиции включает поступление глазной капли из глазного дозатора.

RU 2 6 1 3 7 1 5 C 2

RU 2 6 1 3 7 1 5 C 2