



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2013117209/15, 08.11.2011

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

08.11.2010 US 61/411,464;

08.11.2010 US 61/411,466

(43) Дата публикации заявки: 27.10.2014 Бюл. № 30

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 16.04.2013

(86) Заявка РСТ:

IL 2011/000866 (08.11.2011)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2012/063237 (18.05.2012)

Адрес для переписки:

123242, Москва, Кудринская площадь, 1, а/я 35,  
"Михайлюк, Сороколат и партнеры-патентные  
поверенные"

(71) Заявитель(и):

ХИЛОР ЛТД. (IL)

(72) Автор(ы):

ТЕННЕНБАУМ Тамар (IL),

БРЕЙМАН-УИКСМАН Лиора (IL),

САГИВ Ювал (IL),

ЛЕВИ-ХАЧАМ Офра (IL)

(54) **БУФЕРНЫЕ ГЛАЗНЫЕ КОМПОЗИЦИИ И СПОСОБЫ ИХ ПРИМЕНЕНИЯ**

## (57) Формула изобретения

## 1. Формула изобретения

Глазная композиция, включающая

а) 0,1-2,0% (вес./об.) натрия хлорида;

b) 0,01-0,5% (вес./об.) калия хлорида;

с) 0,01-1,0% (вес./об.) ацетата натрия тригидрата;

d) 0,01-1,0% (вес./об.) цитрата тринатрия дигидрата;

е) воду и

f) одно или несколько фармацевтически активных средств.

2. Глазная композиция по п. 1, где композиция включает 0,6-0,8% (вес./об.) натрия хлорида.

3. Глазная композиция по п. 1, где композиция включает 0,07-0,09% (вес./об.) калия хлорида.

4. Глазная композиция по п. 1, где композиция включает 0,3-0,5% (вес./об.) ацетата натрия тригидрата.

5. Глазная композиция по п. 1, где композиция включает 0,1-0,3% (вес./об.) цитрата тринатрия дигидрата.

6. Глазная композиция по п. 1, где композиция имеет рН от приблизительно 5,5 до 8,0 или от приблизительно 6,8 до 7,6.

7. Глазная композиция по п. 6, где композиция имеет рН приблизительно 7,2.
8. Глазная композиция по п. 1, где композиция имеет осмоляльность от 220 до 320 мосмоль/кг.
9. Глазная композиция по п. 1, где композиция имеет осмоляльность приблизительно 300 мосмоль/кг.
10. Глазная композиция по п. 1, где композиция имеет вязкость от приблизительно 1 до 50000 сП.
11. Глазная композиция по п. 1, где фармацевтически активное средство выбрано из группы, включающей анестезирующие, вяжущие, антигипертензивные, противоглаукомные, нейропротекторные, антиаллергические, усиливающие секрецию слизи, ангиостатические, антимикробные, болеутоляющие или противовоспалительные средства.
12. Глазная композиция по п. 11, где фармацевтическое активное средство выбрано из группы, включающей полипептид, олигонуклеотид, гормон, химическое соединение или липид.
13. Глазная композиция по п. 1, где фармацевтически активным средством является ингибитор РКС- $\alpha$ , ингибитор РКС- $\epsilon$ , ингибитор РКС- $\delta$  или активатор РКС- $\delta$ .
14. Глазная композиция по п. 13, где ингибитором является полипептид.
15. Глазная композиция по п. 14, где ингибитор имеет длину от 5 до 20 аминокислот.
16. Глазная композиция по п. 15, где полипептид включает аминокислотную последовательность, выбранную из SEQ ID NO: 1-6, 12, 14, 17, и его физиологически приемлемые соли.
17. Глазная композиция по п. 16, где полипептид включает N-концевую модификацию, C-концевую модификацию или их комбинацию.
18. Глазная композиция по п. 17, где полипептид является N-ацилированным.
19. Глазная композиция по п. 18, где полипептид является N-миристоилированным или N-пальмитоилированным.
20. Глазная композиция по п. 16, где полипептид выбран из SEQ ID NO: 7-11, 13, 15, 16 и 18.
21. Глазная композиция по п. 1, где фармацевтически активным средством является инсулин.
22. Глазная композиция по п. 13, где композиция дополнительно включает инсулин.
23. Глазная композиция по п. 13, где композиция включает инсулин в комбинации с ингибитором РКС- $\alpha$ .
24. Глазная композиция по п. 1, где композиция дополнительно включает буферное средство, консервант, средство, регулирующее тоничность, средство, уменьшающее раздражение, увлажняющее средство, поверхностно-активное средство, растворитель, стабилизатор, средство, повышающее комфорт, смягчающее вещество, средство, регулирующее рН, смачивающее средство, средство, ингибирующее агрегацию, средство, модифицирующее заряд, ингибитор ферментов деградации, усилитель проницаемости мембраны, комплексообразующее средство (хелатирующее средство), сосудорасширяющее или регулирующее вязкость средство.
25. Глазная композиция по п. 1, где композиция включает менее 0,03% (вес./об.) хлорида кальция дигидрата или хлорида магния гексагидрата.
26. Глазная композиция включающая
  - a) 0,1-2,0% (вес./об.) натрия хлорида;
  - b) 0,01-0,5% (вес./об.) калия хлорида;
  - c) 0,01-1,0% (вес./об.) ацетата натрия тригидрата;
  - d) 0,01-1,0% (вес./об.) цитрата тринатрия дигидрата и
  - e) воду, при условии, что композиция включает менее 0,03% (вес./об.) хлорида кальция

дигидрата или хлорида магния гексагидрата.

27. Способ ускорения или обеспечения заживления поврежденной глазной ткани или раны глаза у субъекта, при котором применяют глазную композицию на глаз субъекта, где глазная композиция включает

- а) 0,1-2,0% (вес./об.) натрия хлорида;
- б) 0,01-0,5% (вес./об.) калия хлорида;
- с) 0,01-1,0% (вес./об.) ацетата натрия тригидрата;
- д) 0,01-1,0% (вес./об.) цитрата тринатрия дигидрата и
- е) воду.

28. Способ смачивания глаза, при котором местно применяют глазную композицию на глаза субъекта, где глазная композиция включает

- а) 0,1-2,0% (вес./об.) натрия хлорида;
- б) 0,01-0,5% (вес./об.) калия хлорида;
- с) 0,01-1,0% (вес./об.) ацетата натрия тригидрата;
- д) 0,01-1,0% (вес./об.) цитрата тринатрия дигидрата и
- е) воду.

29. Способ доставки фармацевтического средства субъекту, при котором местно применяют глазную композицию на глаз субъекта, где глазная композиция включает

- а) 0,1-2,0% (вес./об.) натрия хлорида;
- б) 0,01-0,5% (вес./об.) калия хлорида;
- с) 0,01-1,0% (вес./об.) ацетата натрия тригидрата;
- д) 0,01-1,0% (вес./об.) цитрата тринатрия дигидрата;
- е) воду и
- ф) фармацевтически активное средство.

30. Набор, включающий глазную композицию по п. 1 или 26.

31. Набор по п. 30, где набор дополнительно включает инструкции по применению композиции.