



(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 42290 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/5575; A61K 47/10; A61P 27/06; A61K 9/06; A61K 47/32**
- (43) Date de publication : **30.11.2018**
-
- (21) N° Dépôt : **42290**
- (22) Date de Dépôt : **08.06.2016**
- (30) Données de Priorité : **09.06.2015 EP 15171233**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2016/062990 08.06.2016**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation:EP16729525.2
- (71) Demandeur(s) : **MEDproject Pharma-Entwicklungs- und Vertriebsgesellschaft mbH, Bajuwarenring 14 82041 Oberhaching (DE)**
- (72) Inventeur(s) : **POLZER, Heinz ; ELENA, Pierre-Paul ; SENGE, Jürgen**
- (74) Mandataire : **SABA & CO. TMP**
-
- (54) Titre : **GEL FLUIDE OPHTALMIQUE DE BIMATOPROST**
- (57) Abrégé : L'invention concerne un gel ophtalmique administrable sous forme de gouttes, ledit gel ayant une composition comprenant du bimatoprost en une quantité comprise entre 0,003 et 0,03 % en poids, du polyacrylate en une quantité > 0,2 % en poids, de la polyvidone (PVP), du dextrane, des polyéthylène glycols (PEG), de la carboxyméthyl cellulose (CMC) ou de l'alcool polyvinylique (PVA) en une quantité comprise entre 0,2 et 10 % en poids, un agent d'isotonisation en une quantité permettant d'atteindre une osmolalité comprise entre 200 et 400 mosml/kg, un sel pour régler la viscosité en une quantité comprise entre 0,05 et 0,4 % en poids, une base en une quantité permettant de régler le pH compris entre 6 et 8 et des excipients normalement utilisés dans des gels ophtalmiques, à une viscosité se situant dans la plage comprise entre 200 et 2 000 mPa·s.

REVENDICATIONS

1. Gel ophtalmique pour instillation, ledit gel comprenant
 - 1) du bimatoprost en une quantité de 0,003 à 0,03 % en poids,
 - 2a) du polyacrylate en une quantité de > 0,2 % en poids,
 - 2b) de la povidone, du dextrans, du polyéthylène glycol, de la carboxyméthylcellulose ou du poly(alcool vinylique) en une quantité de 0,2 à 10,0 % en poids,
 - 3) un isotonisant en une quantité permettant de produire une osmolalité de 200 à 400 mosmol/kg, de préférence 270 à 330 mosmol/kg,
 - 4) un sel pour ajuster la viscosité en une quantité de 0,05 à 0,4 % en poids,
 - 5) une base en une quantité permettant d'ajuster le pH à 6 à 8, de préférence un pH de 7,3,
 - 6) des excipients normalement utilisés dans les gels ophtalmiques, et
 - 7) de l'eau.et ayant une viscosité dans la plage de 200 à 2000 mPa · s, mesurée au moyen d'un viscosimètre RVDV-II de Brookfield à 25 °C.
2. Gel ophtalmique pour instillation selon la revendication 1, caractérisé en ce que la quantité de polyacrylate est dans la plage de > 0,2 % à 3,0 % en poids, de préférence dans la plage de > 0,2 % à 0,7 % en poids.
3. Gel ophtalmique pour instillation selon les revendications 1 ou 2, caractérisé en ce que la quantité de povidone est dans la plage de > 0,8 % à 10 % en poids, de préférence > 2,5 % à 10 % en poids.
4. Gel selon les revendications 1 à 3, caractérisé en ce que la quantité de bimatoprost est inférieure à 0,01 % en poids, de préférence inférieure à 0,0045 % en poids.
5. Gel selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisé en ce qu'il

comprend du sorbitol, du mannitol ou du glycérol en tant qu'isotonisant en une quantité de 1,2 à 5,5 % en poids.

- 5 6. Gel selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisé en ce qu'il comprend une base en une quantité de 0,1 à 0,8 % en poids.
7. Gel selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisé en ce que la base est du trométamol.
- 10 8. Gel selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisé en ce qu'il contient à titre du polyacrylate de tels types ayant une masse moléculaire entre 1 000 000 et 4 000 000.
- 15 9. Gel selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisé en ce qu'il ne comprend pas de conservateur.
10. Gel selon les revendications 1 à 8, caractérisé en ce qu'il comprend du chlorure de benzalkonium en tant que conservateur.
- 20 11. Gel selon la revendication 10, caractérisé en ce que la quantité de chlorure de benzalkonium est dans la plage de 0,005 à 0,02 % en poids.
- 25 12. Récipient unidose contenant le gel ophtalmique pour instillation sans conservateur selon l'une quelconque des revendications 1 à 9.
13. Récipient multidose en matière plastique contenant le gel ophtalmique pour instillation avec conservateur selon l'une quelconque des revendications 1 à 8, 10 ou 11.
- 30 14. Gel selon l'une quelconque des revendications 1 à 11 pour utilisation en tant que médicament.

15. Gel selon l'une quelconque des revendications 1 à 11 pour utilisation dans le traitement de la pression intraoculaire élevée.