

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成29年3月2日 (2017.3.2)

【公表番号】特表2016-506966(P2016-506966A)

【公表日】平成28年3月7日 (2016.3.7)

【年通号数】公開・登録公報2016-014

【出願番号】特願2015-556155(P2015-556155)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/417 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 P 27/10 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/417

A 6 1 K 9/08

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/12

A 6 1 P 27/10

【手続補正書】

【提出日】平成29年1月26日 (2017.1.26)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

a . 約 0 . 1 % (w / v) ~ 約 4 % (w / v) のフェントラミンまたはその薬学的に許容される塩 ;

b . 約 1 % (w / v) ~ 約 6 % (w / v) の 250 g / モル未満の分子量を有する少なくとも 1 つのポリオール化合物 ;

c . 約 0 . 1 m M ~ 約 10 m M の少なくとも 1 つの緩衝剤 ; および

d . 水

を含み、キレート剤を含まない水性点眼液であって、

前記点眼液が、4 . 0 ~ 7 . 5 の範囲の pH を有し、キレート剤を含有しない点眼液。

【請求項 2】

前記少なくとも 1 つのポリオール化合物が、マンニトール、グリセロール、プロピレングリコール、エチレングリコール、ソルビトール、またはキシリトールである、請求項 1 に記載の点眼液。

【請求項 3】

前記少なくとも 1 つのポリオール化合物がマンニトールである、請求項 1 に記載の点眼液。

【請求項 4】

前記少なくとも 1 つのポリオール化合物がグリセロールである、請求項 1 に記載の点眼液。

【請求項 5】

前記少なくとも 1 つのポリオール化合物がプロピレングリコールである、請求項 1 に記載の点眼液。

【請求項 6】

前記少なくとも 1 つのポリオール化合物がマンニトールであり、前記点眼液がグリセロールをさらに含む、請求項 1 に記載の点眼液。

【請求項 7】

前記少なくとも 1 つのポリオール化合物がマンニトールであり、前記点眼液がプロピレングリコールをさらに含む、請求項 1 に記載の点眼液。

【請求項 8】

前記少なくとも 1 つのポリオール化合物がグリセロールであり、前記点眼液がプロピレングリコールをさらに含む、請求項 1 に記載の点眼液。

【請求項 9】

前記点眼液が約 2 % (w/v) ~ 約 5 % (w/v) の前記少なくとも 1 つのポリオール化合物を含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 10】

前記点眼液が約 3 . 5 % (w/v) ~ 約 4 . 5 % (w/v) の前記少なくとも 1 つのポリオール化合物を含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 11】

前記点眼液が約 4 % (w/v) の前記少なくとも 1 つのポリオール化合物を含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 12】

ポリ (C₂ ~ C₄ アルキレン) グリコールポリマーをさらに含む、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 13】

前記ポリ (C₂ ~ C₄ アルキレン) グリコールポリマーがポリプロピレングリコールである、請求項 12 に記載の点眼液。

【請求項 14】

デキストランをさらに含む、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 15】

約 0 . 01 % (w/v) ~ 約 1 % (w/v) のデキストランをさらに含む、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 16】

前記デキストランが、約 65,000 g/mol ~ 約 75,000 g/mol の範囲の重量平均分子量を有する、請求項 14 または 15 に記載の点眼液。

【請求項 17】

セルロース剤をさらに含む、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 18】

約 0 . 01 % (w/v) ~ 約 2 % (w/v) のセルロース剤をさらに含む、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 19】

前記セルロース剤がヒドロキシプロピルメチルセルロースである、請求項 17 または 18 に記載の点眼液。

【請求項 20】

前記セルロースローズ剤が、セルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、またはヒドロキシプロピルセルロースである、請求項 17 または 18 に記載の点眼液。

【請求項 21】

前記緩衝剤が約 2 mM ~ 約 4 mM の範囲の濃度で存在する、請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 22】

前記緩衝剤が約 3 mM の濃度で存在する、請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 23】

前記緩衝剤がアルカリ金属アルキルカルボン酸塩を含む、請求項 1 ~ 22 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 24】

前記緩衝剤がアルカリ金属酢酸塩を含む、請求項 1 ~ 22 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 25】

前記緩衝剤が酢酸ナトリウムを含む、請求項 1 ~ 22 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 26】

前記点眼液が 4.5 ~ 6.0 の範囲の pH を有する、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 27】

前記点眼液が 4.7 ~ 5.1 の範囲の pH を有する、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 28】

前記点眼液が約 0.5 % (w/v) ~ 約 2 % (w/v) のフェントラミンまたはその薬学的に許容される塩を含む、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 29】

前記点眼液が約 1 % (w/v) のフェントラミンまたはその薬学的に許容される塩を含む、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 30】

前記点眼液が約 0.1 % (w/v) ~ 約 4 % (w/v) のフェントラミンメシレートを含む、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 31】

前記点眼液が約 0.25 % (w/v) ~ 約 2 % (w/v) のフェントラミンメシレートを含む、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 32】

前記点眼液が約 0.25 % (w/v) ~ 約 1 % (w/v) のフェントラミンメシレートを含む、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 33】

前記点眼液が約 1 % (w/v) のフェントラミンメシレートを含む、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 34】

防腐剤、酸化防止剤、粘度調整剤、安定剤、張性調整剤、角膜透過促進剤、または界面活性剤の 1 つもしくは複数をさらに含む、請求項 1 ~ 33 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 35】

- a. 約 0.25 % (w/v) ~ 約 2 % (w/v) のフェントラミンメシレート；
- b. 約 1 % (w/v) ~ 約 6 % (w/v) のマンニトール、グリセロール、およびプロピレングリコールからなる群から選択される少なくとも 1 つのポリオール化合物；
- c. 約 1 mM ~ 約 6 mM のアルカリ金属酢酸塩；ならびに

d . 水

を含み、キレート剤を含まない水性点眼液であって、

前記点眼液が、4 . 5 ~ 5 . 5 の範囲のpHを有し、キレート剤を含有しない点眼液。

【請求項36】

前記点眼液が約0 . 25 % (w / v) ~ 約1 % (w / v) のフェントラミンメシレートを含む、請求項35に記載の点眼液。

【請求項37】

前記点眼液が約1 % (w / v) ~ 約4 % (w / v) マンニトールを含む、請求項35または36に記載の点眼液。

【請求項38】

前記点眼液が約4 % (w / v) マンニトールを含む、請求項37に記載の点眼液。

【請求項39】

前記アルカリ金属酢酸塩が酢酸ナトリウムである、請求項35 ~ 38 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項40】

前記点眼液が3 m M の酢酸ナトリウムを含む、請求項35 ~ 39 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項41】

前記点眼液が (i) 約0 . 25 % (w / v) ~ 約2 % (w / v) のフェントラミンメシレート ; (i i) 約1 % (w / v) ~ 約6 % (w / v) のマンニトール、グリセロール、およびプロピレングリコールからなる群から選択される1つまたは複数のポリオール化合物 ; (i i i) 約1 m M ~ 約6 m M のアルカリ金属酢酸塩 ; (i v) 酢酸 ; ならびに (v) 水からなり、前記点眼液が4 . 5 ~ 5 . 5 の範囲のpHを有する、請求項35に記載の点眼液。

【請求項42】

a . 約0 . 25 % (w / v) ~ 約2 % (w / v) のフェントラミンメシレート ;

b . 約3 % (w / v) ~ 約5 % (w / v) のマンニトール ;

c . 約2 m M ~ 約4 m M の酢酸ナトリウム ; および

d . 水

を含み、キレート剤を含まない水性点眼液であって、

前記点眼液が、4 . 5 ~ 5 . 2 の範囲のpHを有し、キレート剤を含有しない点眼液。

【請求項43】

a . 約0 . 5 % (w / v) ~ 約1 % (w / v) のフェントラミンメシレート ;

b . 約4 % マンニトール ;

c . 約3 m M 酢酸ナトリウム ; および

d . 水

を含み、キレート剤を含まない水性点眼液であって、

前記点眼液が、4 . 6 ~ 5 . 2 の範囲のpHを有し、キレート剤を含有しない点眼液。

【請求項44】

前記フェントラミンまたはその薬学的に許容される塩の2 % 未満が25 で12週間の貯蔵時に分解する、請求項1 ~ 43 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項45】

前記フェントラミンまたはその薬学的に許容される塩の2 % 未満が25 で24週間の貯蔵時に分解する、請求項1 ~ 43 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項46】

前記フェントラミンまたはその薬学的に許容される塩の7 % 未満が40 で12週間の貯蔵時に分解する、請求項1 ~ 45 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項47】

患者の視機能を改善するための請求項1 ~ 46 のいずれか一項に記載の水性点眼液。

【請求項48】

視機能の前記改善が視力の改善である、請求項 4 7 に記載の点眼液。

【請求項 4 9】

視機能の前記改善が暗順応条件下での視力の改善である、請求項 4 7 に記載の点眼液。

【請求項 5 0】

視機能の前記改善が薄明視条件下での視力の改善である、請求項 4 7 に記載の点眼液。

【請求項 5 1】

視機能の前記改善が明所視条件下での視力の改善である、請求項 4 7 に記載の点眼液。

【請求項 5 2】

視機能の前記改善がコントラスト感度の改善である、請求項 4 7 に記載の点眼液。

【請求項 5 3】

視機能の前記改善が暗順応条件下でのコントラスト感度の改善である、請求項 4 7 に記載の点眼液。

【請求項 5 4】

視機能の前記改善が薄明視条件下でのコントラスト感度の改善である、請求項 4 7 に記載の点眼液。

【請求項 5 5】

視機能の前記改善が明所視条件下でのコントラスト感度の改善である、請求項 4 7 に記載の点眼液。

【請求項 5 6】

患者の瞳孔径を減少させるための請求項 1 ~ 4 6 のいずれか一項に記載の水性点眼液。

【請求項 5 7】

薄明視条件下での瞳孔径の前記減少が、同じ薄明視条件下であるが前記水性点眼液を受けていない患者の瞳孔径と比較して少なくとも 5 % である、請求項 5 6 に記載の点眼液。

【請求項 5 8】

薄明視条件下での瞳孔径の前記減少が、同じ薄明視条件下であるが前記水性点眼液を受けていない患者の瞳孔径と比較して少なくとも 1 0 % である、請求項 5 6 に記載の点眼液。

【請求項 5 9】

前記患者が、同じ薄明視条件下であるが前記水性点眼液を受けていない患者の瞳孔の直径に対して薄明視条件下に測定された時に少なくとも 0 . 5 mm の瞳孔径の減少を体験する、請求項 5 6 に記載の点眼液。

【請求項 6 0】

前記患者が、同じ薄明視条件下であるが前記化合物を受けていない患者の瞳孔の直径に対して薄明視条件下に測定された時に約 0 . 6 mm ~ 約 3 mm の範囲の瞳孔径の減少を体験する、請求項 5 6 に記載の点眼液。

【請求項 6 1】

前記患者が、同じ薄明視条件下であるが前記水性点眼液を受けていない患者の瞳孔の直径に対して薄明視条件下に測定された時に約 0 . 6 mm ~ 約 1 . 2 mm の範囲の瞳孔径の減少を体験する、請求項 5 6 に記載の点眼液。

【請求項 6 2】

患者の目における散乱光線の異常焦点整合を減少させるための請求項 1 ~ 4 6 のいずれか一項に記載の水性点眼液。

【請求項 6 3】

前記患者の就寝時に投与される、請求項 4 7 ~ 6 2 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 6 4】

前記水性点眼液の投与による前記患者のいかなる目の充血も、前記患者への前記水性点眼液の投与後 8 時間以内に治まってしまう、請求項 4 7 ~ 6 3 のいずれか一項に記載の点眼液。

【請求項 6 5】

前記方法がスネレン視力表を用いて測定される前記患者の視覚の少なくとも 2 ライン改

善で特徴づけられる視力の改善をもたらす、請求項 4 7 ~ 6 4 のいずれか一項に記載の点
眼液。

【請求項 6 6】

前記患者がヒトである、請求項 4 7 ~ 6 5 のいずれか一項に記載の点眼液。