

【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23年11月24日 (2011.11.24)

【公表番号】特表2010-540671(P2010-540671A)

【公表日】平成22年12月24日 (2010.12.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-051

【出願番号】特願2010-528310(P2010-528310)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/12 (2006.01)

A 6 1 P 27/14 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/10 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 31/573

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/10

A 6 1 P 27/12

A 6 1 P 27/14

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 7/10

【手続補正書】

【提出日】平成23年10月7日 (2011.10.7)

【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) 少なくとも 1 つのシクロスポリンと (b) ポリソルベートである界面活性剤と (c) 低分子量親水性ポリマーである非イオン性等張化剤とを含んでなる、水性眼用処方物。

【請求項 2】

前記水性処方物が (d) 少なくとも緩衝剤をさらに含んでなり、pH が少なくとも 3 ヶ月間安定している、請求項 1 に記載の眼用処方物。

【請求項 3】

前記シクロスポリンが、シクロスポリン A である、請求項 1 または 2 に記載の眼用処方物。

【請求項 4】

前記界面活性剤 (b) が、ポリソルベート 20、ポリソルベート 40、ポリソルベート 60 およびポリソルベート 80 からなる群から選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 5】

前記界面活性剤 (b) がポリソルベート 80 である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 6】

前記非イオン性等張化剤 (c) が、PEG 200、PEG 300、PEG 400 および PEG 600 からなる群から選択されるポリエチレングリコール PEG である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 7】

前記非イオン性等張化剤 (c) が、ポリエチレングリコール PEG 300 である、請求項 6 に記載の眼用処方物。

【請求項 8】

前記水性処方物が、(a) 少なくとも 1 つのシクロスポリンと (b) ポリソルベート 80 と (c) PEG 300 とを含んでなる、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 9】

0.004% ~ 0.1% w/v 間のシクロスポリンを含有している、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 10】

0.004% ~ 0.05% w/v 間のシクロスポリンを含有している、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 11】

0.001% ~ 0.049% w/v 以下間のシクロスポリンを含有している、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 12】

0.02% w/v 以下のシクロスポリンを含有している、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 13】

0.01 重量% ~ 約 5 重量% の成分 (b) を含有している、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 14】

0.5 重量% 未満の成分 (b) を含有している、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 15】

0.2 重量% ~ 0.3 重量% の成分 (b) を含有している、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 16】

9 重量% 未満の PEG 300 を含有している、請求項 7 に記載の眼用処方物。

【請求項 17】

7重量%のPEG300を含有している、請求項7に記載の眼用処方物。

【請求項 18】

0.1%～0.5%間の緩衝剤(d)を含有している、請求項1～17のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 19】

(e)少なくとも1つのコルチコステロイドを含んでなる、請求項1～18のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 20】

前記コルチコステロイドが、1'- , 17'- , 21-トリヒドロキシプレゲン-4-エン-3, 20-ジオン; 11'- , 16'- , 17, 21-テトラヒドロキシプレゲン-4-エン-3, 20-ジオン; 11'- , 16'- , 17, 21-テトラヒドロキシプレゲン-1, 4-ジエン-3, 20-ジオン; 11'- , 17'- , 21-トリヒドロキシ-6'- -メチルプレゲン-4-エン-3, 20-ジオン; 11-デヒドロコルチコステロン; 11-デオキシコルチゾール; 11-ヒドロキシ-1, 4-アンドロスタジエン- -3, 17-ジオン; 11-ケトテストステロン; 14-ヒドロキシアンドロスタ-4-エン-3, 6, 17-トリオン; 15, 17-ジヒドロキシプロゲステロン; 16-メチルヒドロコルチゾン; 17, 21-ジヒドロキシ-16'- -メチルプレグナ-1, 4, 9(11)-トリエン-3, 20-ジオン; 17'- -ヒドロキシプレゲン-4-エン-3, 20-ジオン; 17'- -ヒドロキシプレグネノロン; 17-ヒドロキシ-16'- -メチル-5'- -プレゲン-9(11)-エン-3, 20-ジオン; 17-ヒドロキシ-4, 6, 8(14)-プレグナトリエン-3, 20-ジオン; 17-ヒドロキシプレグナ-4, 9(11)-ジ-エン-3, 20-ジオン; 18-ヒドロキシコルチコステロン; 18-ヒドロキシコルチゾン; 18-オキシコルチゾール; 21-アセトキシプレグネノロン; 21-デオキシアルドステロン; 21-デオキシコルチゾン; 2-デオキシエクジソン; 2-メチルコルチゾン; 3-デヒドロエクジソン; 4-プレグネン-17'- , 20'- , 21-トリオール-3, 11-ジオン; 6, 17, 20-トリヒドロキシプレゲン- -4-エン-3-オン; 6'- -ヒドロキシコルチゾール; 6'- -フルオロブレドニゾロン、6'- -メチルブレドニゾロン、6'- -メチルブレドニゾロン 21-アセテート、6'- -メチルブレドニゾロン 21-ヘミスクシネートナトリウム塩、6'- -ヒドロキシコルチゾール、6'- , 9'- -ジフルオロブレドニゾロン 21-アセテート 17-ブチレート、6-ヒドロキシコルチコステロン; 6-ヒドロキシデキサメタゾン; 6-ヒドロキシブレドニゾロン; 9-フルオロコルチゾン; ジプロピオン酸アルクロメタゾン; アルドステロン; アルゲストン; アルファダーム:アマジノン; アムシノニド; アナゲストン; アンドロステンジオン; 酢酸アネコルタブ; ベクロメタゾン; ジプロピオン酸ベクロメタゾン; ベタメタゾン 17-バレレート; 酢酸ベタメタゾンナトリウム; リン酸ベタメタゾンナトリウム; 吉草酸ベタメタゾン; ボラステロン; ブデソニド; カルステロン; クロルマジノン; クロロブレドニゾン; 酢酸クロロブレドニゾン; コレステロール; シクレソニド; クロベタゾール; プロピオン酸クロベタゾール; クロベタゾン; クロコルトロン; ピバル酸クロコルトロン; クロゲストン; クロブレドノール; コルチコステロン; コルチゾール; 酢酸コルチゾール; 酪酸コルチゾール; シピオン酸コルチゾール; オクタン酸コルチゾール; リン酸コルチゾールナトリウム; コハク酸コルチゾールナトリウム; 吉草酸コルチゾール; コルチゾン; 酢酸コルチゾン; コルチバゾール; コルトドキソン; ダツラオロン; デフラザコルト、21-デオキシコルチゾール、デヒドロエピアンドロステロン; デルマジノン; デオキシコルチコステロン; デプロドン; デスシノロン; デソニド; デスオキシメタゾン; デキサフェン; デキサメタゾン; デキサメタゾン 21-アセテート; 酢酸デキサメタゾン; リン酸デキサメタゾンナトリウム; ジクロリソン; ジフロラゾン; 二酢酸ジフロラゾン; ジフルコルトロン; ジフルブレドナート; ジヒドロエラテリシンa; ドモブレドナート; ドキシベタゾール; エクジソン; エクジステロン; エモキシロン; エンドリソン; エノキシロン; フルアザコート; フルシノロ

ン；フルクロロニド；フルドロコルチゾン；酢酸フルドロコルチゾン；フルゲストン；フルメタゾン；ピバル酸フルメタゾン；フルモキシニド；フルニソリド；フルオシノロン；フルオシノロンアセトニド；フルオシノニド；フルオコルチンブチル；9 - フルオロコルチゾン；フルオコルトロン；フルオロヒドロキシアンドロステンジオン；フルオロメトロニ；酢酸フルオロメトロニ；フルオキシメステロン；酢酸フルベロロン；フルブレドニデン；フルブレドニゾロン；フルランドレノリド；フルチカゾン；プロピオン酸フルチカゾン；ホルメボロン；ホルメスタン；ホルモコルタール；ゲストノロン；グリデリニン；ハルシノニド；プロピオン酸ハロベタソール；ハロメタゾン；ハロブレドン；ハロプロゲステロン；ヒドロコルタマート；ヒドロコルチオゾンシピオネート；ヒドロコルチゾン；ヒドロコルチゾン 21 - ブチレート；アセボン酸ヒドロコルチゾン；酢酸ヒドロコルチゾン；ヒドロコルチゾンブテプレート；酪酸ヒドロコルチゾン；シピオン酸ヒドロコルチゾン；ヘミコハク酸ヒドロコルチゾン；ヒドロコルチゾンプロブテート；リン酸ヒドロコルチゾンナトリウム；コハク酸ヒドロコルチゾンナトリウム；吉草酸ヒドロコルチゾン；ヒドロキシプロゲステロン；イノコステロン；イソフルブレドン；酢酸イソフルブレドン；イソブレドニデン；エタボン酸ロテブレドノール；メクロリゾン；メコルトロン；メドロゲストン；メドロキシプロゲステロン；メドリソン；メゲストロール；酢酸メゲストロール；メレンゲストロール；メブレドニゾン；メタンドロステノロン；メチルブレドニゾロン；アセボン酸メチルブレドニゾロン；酢酸メチルブレドニゾロン；ヘミコハク酸メチルブレドニゾロン；コハク酸メチルブレドニゾロンナトリウム；メチルテストステロン；メトリボロン；モメタゾン；フロ酸モメタゾン；フロ酸モメタゾンー水和物；ニゾン；ノメゲストロール；ノルゲストメト；ノルビニステロン；オキシメステロン；パラメタゾン；酢酸パラメタゾン；ポナステロン；ブレドニカルバート；ブレドニソラメート；ブレドニゾロン；ブレドニゾロン 21 - ジエチルアミノアセテート；ブレドニゾロン 21 - ヘミスクシネート；酢酸ブレドニゾロン；ファルネシル酸ブレドニゾロン；ヘミコハク酸ブレドニゾロン；ブレドニゾロン - 21 (- D - グルクロニド)；メタスルホ安息香酸ブレドニゾロン；リン酸ブレドニゾロンナトリウム；ブレドニゾロンステアゲラート；テプト酸ブレドニゾロン；テトラヒドロフタル酸ブレドニゾロン；ブレドニゾン；ブレドニバル；ブレドニリデン；プレグネノロン；プロシノニド；トラロニド；プロゲステロン；プロメゲストン；ラボンティステロン；リメキシロン；ロキシボロン；ルプロステロン；スチゾフィリン；チキソコルトール；トブテロン；トリウムシノロン；トリウムシノロンアセトニド；トリウムシノロンアセトニド 21 - バルミテート；トリウムシノロンベネトニド；二酢酸トリウムシノロン；トリウムシノロンヘキサアセトニド；トリメゲストン；ツルケステロン；およびウォルトマンニンからなる群から選択される、請求項 19 に記載の眼用処方物。

【請求項 21】

前記コルチコステロイドが、ブレドニゾロンである、請求項 20 に記載の眼用処方物。

【請求項 22】

前記コルチコステロイドが、酢酸ブレドニゾロンまたはリン酸ブレドニゾロンナトリウムである、請求項 21 に記載の眼用処方物。

【請求項 23】

前記コルチコステロイドの量が 0.01% ~ 4% である、請求項 19 ~ 21 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 24】

前記コルチコステロイドの量が 0.01% ~ 0.12% である、請求項 23 に記載の眼用処方物。

【請求項 25】

請求項 1 に記載の眼用処方物を製造するための方法であって、次の工程：

(i) 部分 I の調製工程

- 室温で、所望の量の界面活性剤 (b) と所望の量の等張化剤 (c) とを合わせ、均一溶液を形成するために混合し、

- 所望の量のシクロスポリン (a) を加え、完全溶解まで混合する ;

(i i) 部分 I I の並行調製工程 :

- 前記緩衝剤 (d) および / または防腐剤 (g) を含める場合は室温で精製水に溶解する

(i i i) pH を指定値に調整し、部分 I および部分 I I をプールし、シクロスポリンの均一性および完全溶解性を維持するために混合する工程を含んでなる、方法。

【請求項 26】

眼疾患、および関連の疾患または病気の抑制、治療、または予防に用いるための、請求項 1 ~ 24 のいずれか一項に記載の眼用処方物。

【請求項 27】

前記眼疾患、および関連の疾患または病気が、滲出性および / または炎症性眼障害である、請求項 26 に記載の眼用処方物。

【請求項 28】

前記眼疾患、および関連の疾患または病気が、前眼部の疾患または障害である、請求項 26 に記載の眼用処方物。

【請求項 29】

前記前眼部の疾患または障害が、ブドウ膜炎、アレルギー、無水晶体、偽水晶体、乱視、眼瞼痙攣、白内障、結膜疾患、結膜炎 (アレルギー性結膜炎を含む)、角膜疾患、滲出性もしくは炎症性成分を伴う角膜の疾患もしくは混濁、角膜浮腫、角膜潰瘍、ドライアイ症候群、眼瞼疾患、涙器疾患、涙道閉塞症、レーザー誘発性滲出、近視、老眼、翼状片、瞳孔障害、屈折障害および斜視、細菌もしくはウイルスの感染および眼の手術が原因で起こる眼の炎症性疾患、眼の物理的損傷が原因で起こる眼の炎症性疾患、眼の炎症性疾患が原因で起こる症状 (そう痒、発赤、浮腫および潰瘍を含む)、紅斑、多形滲出性紅斑、結節性紅斑、環状紅斑、浮腫性硬化症、皮膚炎、血管神経性浮腫、喉頭浮腫、声門浮腫、声門下喉頭炎、気管支炎、鼻炎、咽頭炎、副鼻腔炎、喉頭炎、中耳炎、および緑内障からなる群から選択される、請求項 28 に記載の眼用処方物。