

【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 25 年 2 月 21 日 (2013.2.21)

【公表番号】特表 2011-512362 (P2011-512362A)

【公表日】平成 23 年 4 月 21 日 (2011.4.21)

【年通号数】公開・登録公報 2011-016

【出願番号】特願 2010-546952 (P2010-546952)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/573

C 0 7 D 471/04 1 0 4 H

【手続補正書】

【提出日】平成 23 年 12 月 7 日 (2011.12.7)

【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

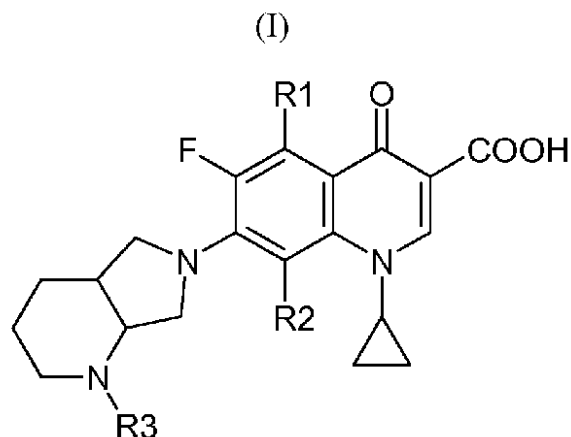
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

局所用の眼科用薬学的組成物であって、
薬学的有効量の、以下の式 (I) :

【化 6】



の化合物のうちの一つ以上および薬学的に受容可能なビヒクルを含有し
式中:

R 1 は H、アミノ、C 1 ~ C 4 アルキルアミノ、または C 1 ~ C 4 ジアルキルアミノであ

り、

R₂ は F、OMe、または H であり；

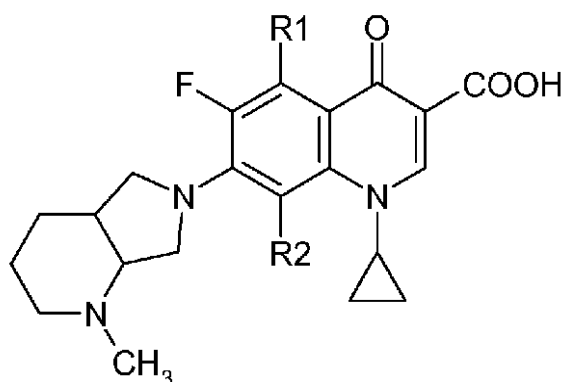
R₃ はメチル、C₂～C₄アルキル、または H であり；そして

R₁ および R₃ のうち少なくとも一つが H ではない、局所用の眼科用薬学的組成物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の局所用の組成物であって、前記式 (I) の化合物が

【化 7】



であり、

式中：

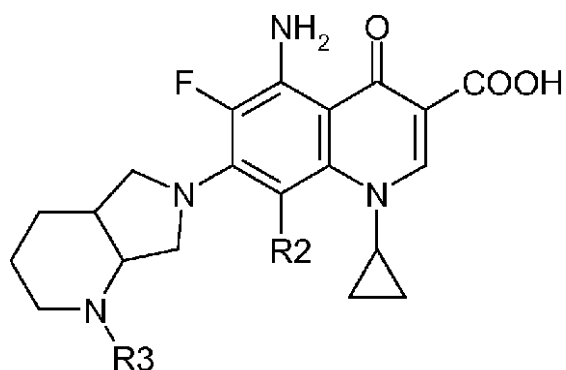
R₁ は H、アミノ、C₁～C₄アルキルアミノ、または C₁～C₄ジアルキルアミノであり；そして

R₂ は F、OCH₃、または H である、局所用の組成物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の局所用の組成物であって、前記式 (I) の化合物が

【化 8】



であり、

式中：

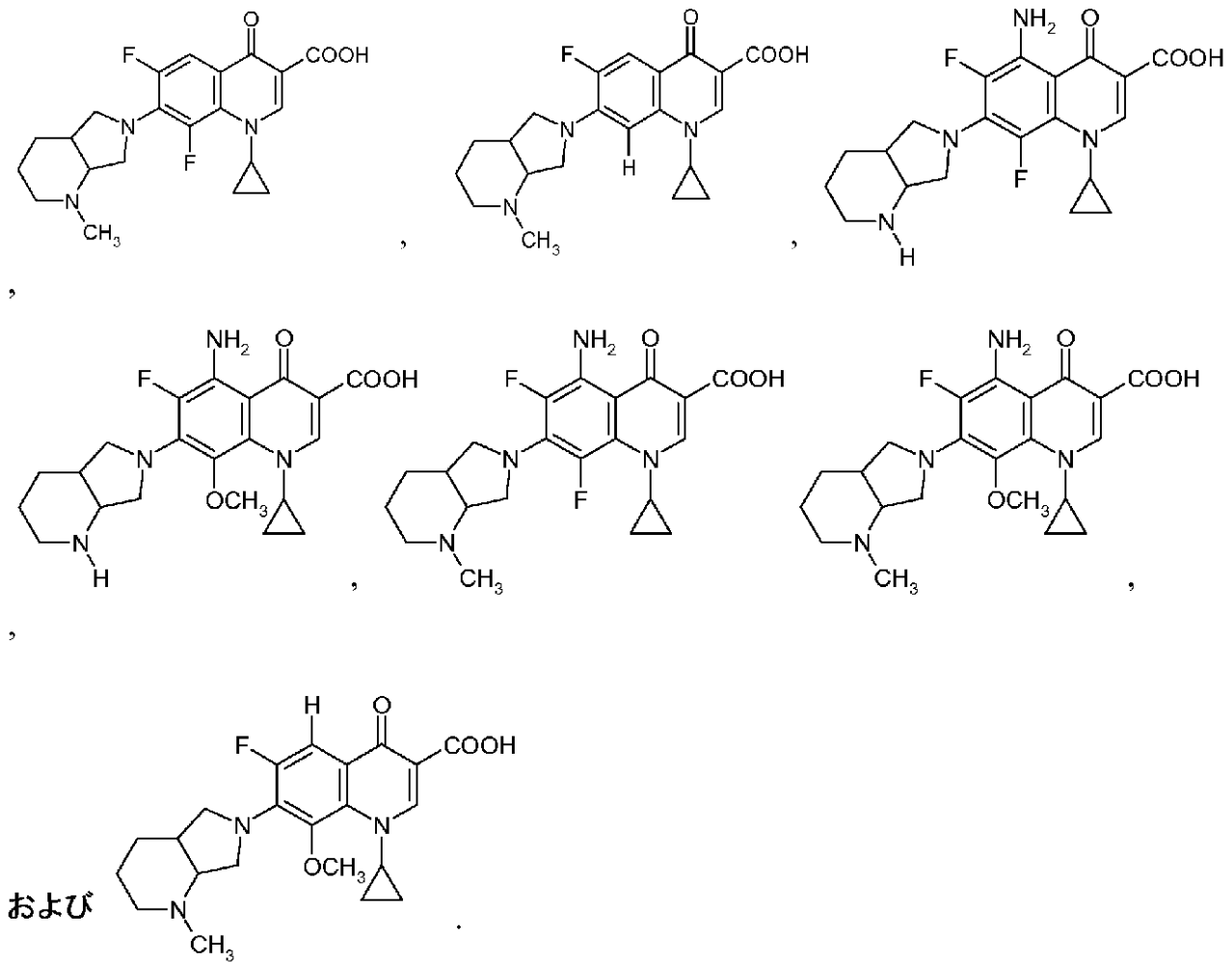
R₂ は F、OCH₃、または H であり；そして

R₃ は CH₃、C₂～C₄アルキル、または H である、局所用の組成物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の局所用の組成物であって、前記式 (I) の化合物が、以下

【化 9】



からなる群より選択される、局所用の組成物。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の局所用の組成物であって、抗炎症剤をさらに含有する、局所用の組成物。

【請求項 6】

請求項 5 に記載の局所用の組成物であって、前記抗炎症剤が、ステロイド抗炎症剤および非ステロイド抗炎症剤からなる群より選択される、局所用の組成物。

【請求項 7】

請求項 5 に記載の局所用の組成物であって、前記抗炎症剤が、デキサメタゾン、プレドニゾロン、リメキシロン、ネパフェナク、およびシロミラストからなる群より選択される、局所用の組成物。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の局所用の組成物であって、前記化合物が、0.05%重量/体積～0.3%重量/体積の濃度で存在する、局所用の組成物。

【請求項 9】

請求項 8 に記載の局所用の組成物であって、前記化合物が、約 0.3%重量/体積の濃度で存在する、局所用の組成物。

【請求項 10】

眼の感染を処置または予防するための請求項 1 に記載の組成物であって、該組成物を眼の組織へと局所的に塗ることを特徴とする、組成物。

【請求項 11】

眼の感染を処置または予防するための請求項 4 に記載の組成物であって、該組成物を

された眼の組織へと局所的に塗ることを特徴とする、組成物。

【請求項 1 2】

請求項 1 0 に記載の組成物であって、前記組成物が、前記化合物を 0 . 0 5 % 重量 / 体積 ~ 0 . 3 % 重量 / 体積の濃度で含有する、組成物。

【請求項 1 3】

請求項 1 2 に記載の組成物であって、前記組成物が、前記化合物を約 0 . 3 % 重量 / 体積の濃度で含有する、組成物。

【請求項 1 4】

請求項 1 0 に記載の組成物であって、前記組成物が、一日に 1 回 ~ 3 回塗られることを特徴とする、組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 0 に記載の組成物であって、前記組成物が、一日に 1 回塗られることを特徴とする、組成物。

【請求項 1 6】

請求項 1 0 に記載の組成物であって、前記組成物が、抗炎症剤を含有する、組成物。

【請求項 1 7】

請求項 1 6 に記載の組成物であって、前記抗炎症剤が、ステロイド抗炎症剤および非ステロイド抗炎症剤からなる群より選択される、組成物。

【請求項 1 8】

請求項 1 7 に記載の組成物であって、前記抗炎症剤が、デキサメタゾン、プレドニゾン、リメキシロン、ネバフェナク、およびシロミラストからなる群より選択される、組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 1】

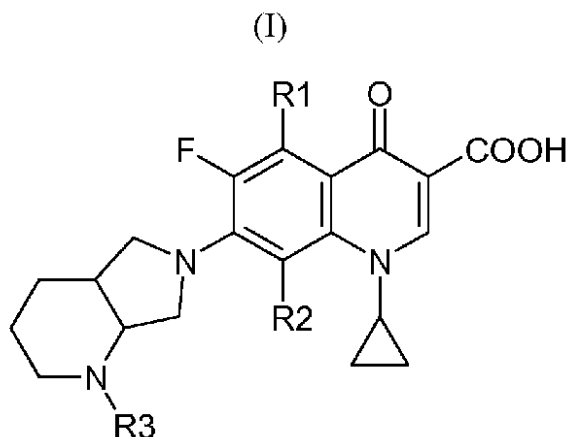
本発明の組成物は組織の外傷（外科的な手順に起因する外傷を含む）の後に起こる感染の予防においてもまた、使用され得る。炎症が特に、組織に対する外科的な外傷または物理的な外傷の後に起こるとき、上記のフルオロキノロンおよび抗炎症剤の組成物はそのような予防において特に有用である。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

（項目 1）

局所用の眼科用薬学的組成物であって、
薬学的有効量の、以下の式（I）：

【化 6】



の化合物のうちの一つ以上および薬学的に受容可能なビヒクルを含有し

式中：

R 1 は H、アミノ、C 1 ～ C 4 アルキルアミノ、または C 1 ～ C 4 ジアルキルアミノであり、

R 2 は F、OMe、または H であり；

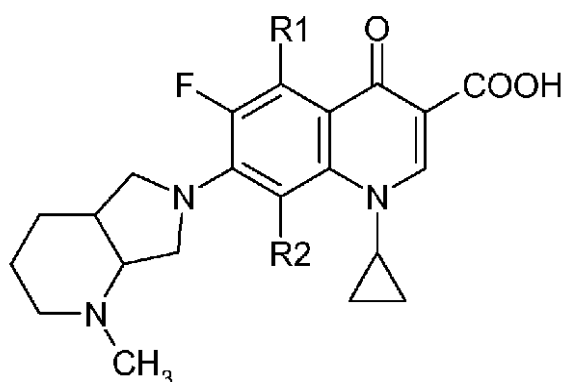
R 3 はメチル、C 2 ～ C 4 アルキル、または H であり；そして

R 1 および R 3 のうち少なくとも一つが H ではない、局所用の眼科用薬学的組成物。

(項目 2)

項目 1 に記載の局所用の組成物であって、前記式 (I) の化合物が

【化 7】



であり、

式中：

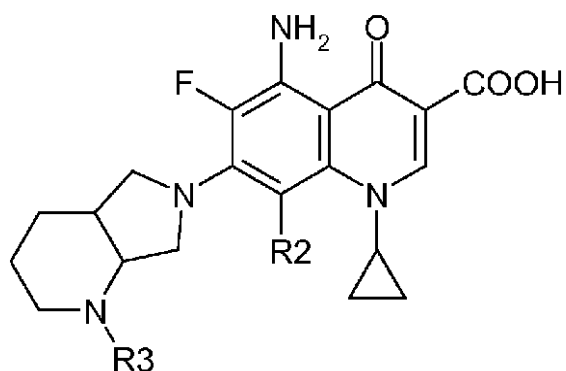
R 1 は H、アミノ、C 1 ～ C 4 アルキルアミノ、または C 1 ～ C 4 ジアルキルアミノであり；そして

R 2 は F、OCH₃、または H である、局所用の組成物。

(項目 3)

項目 1 に記載の局所用の組成物であって、前記式 (I) の化合物が

【化 8】



であり、

式中：

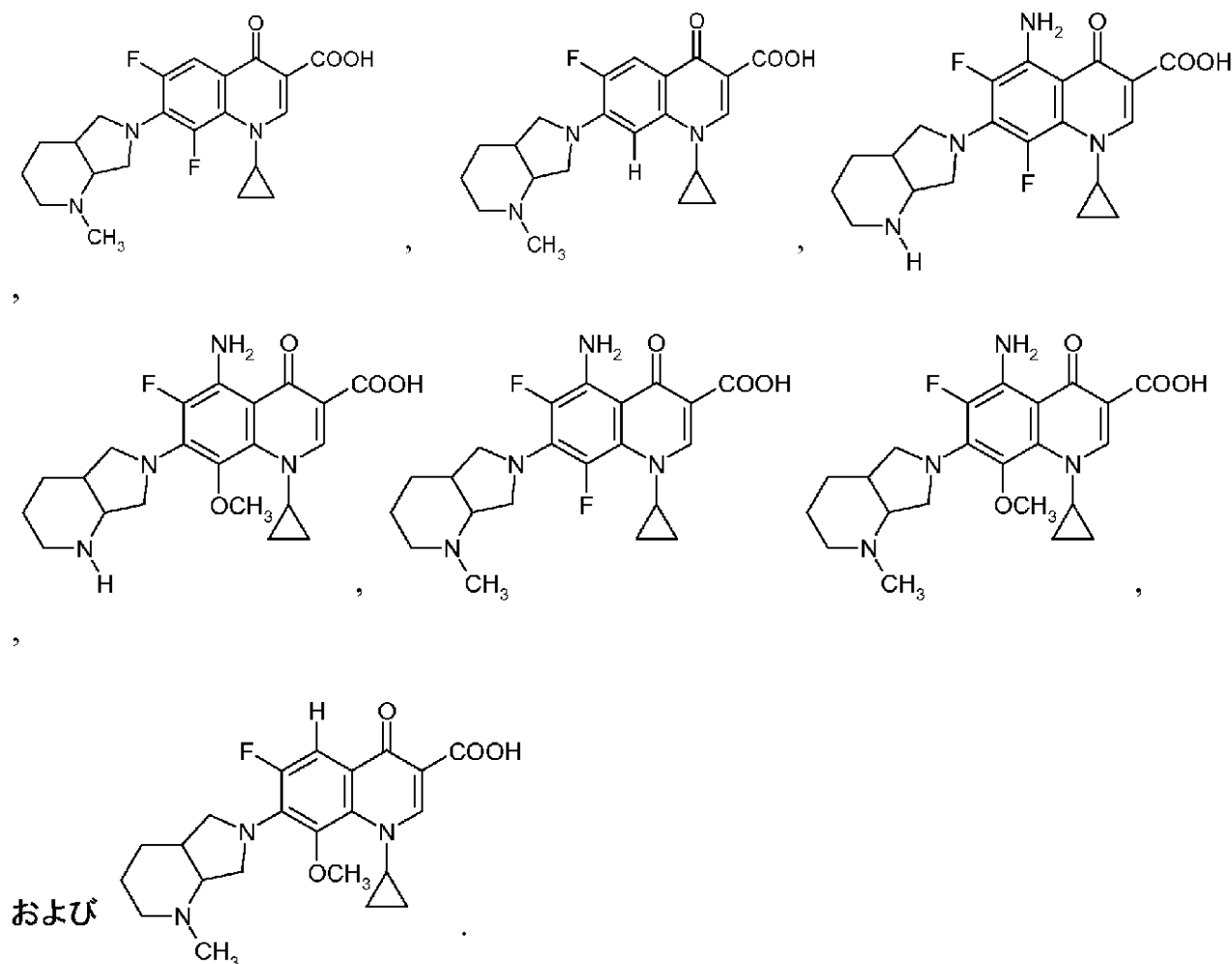
R 2 は F、OCH₃、または H であり；そして

R 3 は CH₃、C 2 ～ C 4 アルキル、または H である、局所用の組成物。

(項目 4)

項目 1 に記載の局所用の組成物であって、前記式 (I) の化合物が、以下

【化 9】



からなる群より選択される、局所用の組成物。

(項目 5)

項目 1 に記載の局所用の組成物であって、抗炎症剤をさらに含有する、局所用の組成物。

(項目 6)

項目 5 に記載の局所用の組成物であって、前記抗炎症剤が、ステロイド抗炎症剤および非ステロイド抗炎症剤からなる群より選択される、局所用の組成物。

(項目 7)

項目 5 に記載の局所用の組成物であって、前記抗炎症剤が、デキサメタゾン、プレドニゾロン、リメキシロン、ネパフェナク、およびシロミラストからなる群より選択される、局所用の組成物。

(項目 8)

項目 1 に記載の局所用の組成物であって、前記化合物が、0.05%重量/体積～0.3%重量/体積の濃度で存在する、局所用の組成物。

(項目 9)

項目 9 に記載の局所用の組成物であって、前記化合物が、約 0.3%重量/体積の濃度で存在する、局所用の組成物。

(項目 10)

眼の感染を処置または予防する方法であって、薬学的有効量の項目 1 の組成物を眼の組織へと局所的に塗る工程を包含する、方法。

(項目 11)

眼の感染を処置または予防する方法であって、薬学的有効量の項目4の組成物を冒された眼の組織へと局所的に塗る工程を包含する、方法。

(項目12)

項目10に記載の方法であって、前記組成物が、前記化合物を0.05%重量/体積~0.3%重量/体積の濃度で含有する、方法。

(項目13)

項目12に記載の方法であって、前記組成物が、前記化合物を約0.3%重量/体積の濃度で含有する、方法。

(項目14)

項目10に記載の方法であって、前記組成物が、一日に1回~3回塗られる、方法。

(項目15)

項目10に記載の方法であって、前記組成物が、一日に1回塗られる、方法。

(項目16)

項目10に記載の方法であって、前記組成物が、抗炎症剤を含有する、方法。

(項目17)

項目10に記載の方法であって、前記抗炎症剤が、ステロイド抗炎症剤および非ステロイド抗炎症剤からなる群より選択される、方法。

(項目18)

項目17に記載の方法であって、前記抗炎症剤が、デキサメタゾン、プレドニゾロン、リメキシロン、ネパフェナク、およびシロミラストからなる群より選択される、方法。