

【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24年8月23日 (2012.8.23)

【公表番号】特表2011-527339(P2011-527339A)

【公表日】平成23年10月27日 (2011.10.27)

【年通号数】公開・登録公報2011-043

【出願番号】特願2011-517270(P2011-517270)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/343 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/343

A 6 1 K 9/08

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/36

【手続補正書】

【提出日】平成24年7月5日 (2012.7.5)

【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】

ミコフェノール酸ナトリウム (NaMPA) から本質的になる眼用溶液であって、該溶液の pH が、約 6.0 ~ 約 8.5 である、眼用溶液。

【請求項 2】

ミコフェノール酸ナトリウム (NaMPA) と；保存剤、粘性強化剤、湿潤剤、抗酸化剤、緩衝剤、滑沢剤、および張度作用物質から選択される 1 つ以上の添加剤とから本質的になる眼用溶液であって、該溶液の pH が、約 6.0 ~ 約 8.5 である、眼用溶液。

【請求項 3】

前記ミコフェノール酸ナトリウムが、約 0.01% (w/v) ~ 約 4.0% (w/v) である、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 4】

前記ミコフェノール酸ナトリウムが、約 0.05% (w/v) ~ 約 3.0% (w/v) である、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 5】

前記ミコフェノール酸ナトリウムが、約 0.1% (w/v) ~ 約 2.0% (w/v) である、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 6】

前記ミコフェノール酸ナトリウムが、約 1 . 0 % (w / v) ~ 約 4 . 0 % (w / v) である、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 7】

p H が約 7 . 0 ~ 約 8 . 0 である、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 8】

p H が約 7 . 0 ~ 約 7 . 5 である、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 9】

前記溶液中の全ナトリウムが、約 0 . 4 ~ 約 2 . 0 % (w / v) である、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 10】

前記溶液中の全ナトリウムが、約 0 . 9 % (w / v) である、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 11】

前記添加剤が、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウム、臭化ベンゾドデシニウム、塩化セチルピリジニウム、クロロブタノール、エチレンジアミン 4 酢酸 (E D T A)、チメロサル、硝酸フェニル水銀、酢酸フェニル水銀、メチル / プロピルパラベン、フェニルエチルアルコール、安息香酸ナトリウム、プロピオン酸ナトリウム、ソルビン酸、および過ホウ酸ナトリウムから選択される保存剤である、請求項 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 12】

前記添加剤が、カルボポールゲル、カルボキシメチルセルロース、デキストラン、ゼラチン、グリセリン、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、ポリエチレングリコール、ポロキサマー 407、ポリソルベート 80、プロピレングリコール、ポリビニルアルコール、およびポリビニルピロリドン (polyvinylpyrrolidone) (ポビドン) から選択される粘性強化剤である、請求項 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 13】

前記添加剤が、酢酸塩、ホウ酸塩、リン酸塩、重炭酸塩、炭酸塩、クエン酸塩、4 ホウ酸塩、ニリン酸塩、トロメタミン、ヒドロキシエチルモルホリン、およびトリスヒドロキシメチルアミノ - メタン (T H A M) から選択される緩衝剤である、請求項 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 14】

前記添加剤が、デキストラン 40、デキストラン 70、デキストロース、グリセリン、塩化カリウム、プロピレングリコール、および塩化ナトリウムから選択される張度作用物質である、請求項 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 15】

前記添加剤が、ポリソルベート 20 および 80、ポロキサマー 282、チロキサポール、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルプロピルセルロース、ポビドン、およびポリビニルアルコールから選択される湿潤剤である、請求項 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 16】

前記添加剤が、プロピレングリコール、エチレングリコール、ポリエチレングリコール、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、デキストラン 40、デキストラン 70、ゼラチン、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポビドン、ペトロラタム、鉱油、およびカルボマーから選択される滑沢剤である、請求項 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 17】

前記添加剤が、リン脂質ベースの滑沢剤である、請求項 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 18】

ナトリウム対イオンが、塩素イオンである、請求項 1 または 2 に記載の眼用溶液。

【請求項 19】

前記塩素イオンが、HCl由来である、請求項18に記載の眼用溶液。

【請求項20】

炎症または自己免疫状態と関係する眼障害を処置するための請求項1～19のいずれか1項に記載の溶液であって、該溶液は、罹患した眼に局所的に投与されることを特徴とする、溶液。

【請求項21】

前記眼障害が、眼の前部に影響を及ぼす、請求項20に記載の溶液。

【請求項22】

前記眼の前部に影響を及ぼす眼障害が、眼瞼炎、角膜炎；虹彩ルベオーシス；Fuchs虹彩異色性虹彩毛様体炎；慢性ブドウ膜炎または前部ブドウ膜炎；結膜炎；アレルギー性結膜炎；乾性角結膜炎；虹彩毛様体炎；虹彩炎；強膜炎；上強膜炎；角膜浮腫；強膜疾患；眼癬痕性類天疱瘡（ocular cicatricial pemphigoid）；毛様体扁平部炎；Posner Schlossman症候群；ベーチェット病；Vogt-Koyanagi-Harada症候群；結膜浮腫；結膜静脈性うっ血；眼窩周囲蜂巣炎；急性涙嚢炎；非特異性脈管炎；および類肉腫症から選択される、請求項21に記載の溶液。

【請求項23】

前記眼障害が、眼の後部に影響を及ぼす、請求項20に記載の溶液。

【請求項24】

前記眼の後部に影響を及ぼす眼の障害が、黄斑浮腫、嚢胞様黄斑浮腫；網膜虚血；および脈絡膜新血管形成；黄斑変性；糖尿病性網膜症；糖尿病性網膜浮腫；網膜剥離；ブドウ膜炎；汎ブドウ膜炎；脈絡膜炎；上強膜炎；強膜炎；散弾網脈絡膜症；網膜脈管炎；脈絡膜脈管不全；脈絡膜血栓症；視神経新血管形成；および視神経炎から選択される、請求項23に記載の溶液。

【請求項25】

前記眼障害が、ブドウ膜炎である、請求項20に記載の溶液。

【請求項26】

前記眼障害がアレルギー性結膜炎である、請求項20に記載の溶液。

【請求項27】

前記眼障害が、乾性角結膜炎である、請求項20に記載の溶液。

【請求項28】

毎日1～4回投与されることを特徴とする、請求項20に記載の溶液。

【請求項29】

2日ごとに1回投与されることを特徴とする、請求項20に記載の溶液。

【請求項30】

4日ごとに1回投与されることを特徴とする、請求項20に記載の溶液。

【請求項31】

毎週1回投与されることを特徴とする、請求項20に記載の溶液。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0010

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0010】

眼用溶液は、治療効果を提供するのに十分な用量で局所的に適用することができる。いくつかの実施形態では、眼用溶液は、1日につき1～8回、罹患した眼に適用することができる。いくつかの実施形態では、眼用溶液は、1日につき1回または2回投与することができる。いくつかの実施形態では、眼用溶液は、眼障害を処置するために、必要に応じて、2日ごとに1回、4日ごとに1回、または1週間につき1回適用することができる。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

ミコフェノール酸ナトリウム (NaMPA) から本質的になる眼用溶液であって、該溶液のpHが、約6.0～約8.5である、眼用溶液。

(項目2)

ミコフェノール酸ナトリウム (NaMPA) と；保存剤、粘性強化剤、湿潤剤、抗酸化剤、緩衝剤、滑沢剤、および張度作用物質から選択される1つ以上の添加剤とから本質的になる眼用溶液であって、該溶液のpHが、約6.0～約8.5である、眼用溶液。

(項目3)

前記ミコフェノール酸ナトリウムが、約0.01% (w/v) ～約4.0% (w/v) である、項目1または2に記載の眼用溶液。

(項目4)

前記ミコフェノール酸ナトリウムが、約0.05% (w/v) ～約3.0% (w/v) である、項目1または2に記載の眼用溶液。

(項目5)

前記ミコフェノール酸ナトリウムが、約0.1% (w/v) ～約2.0% (w/v) である、項目1または2に記載の眼用溶液。

(項目6)

前記ミコフェノール酸ナトリウムが、約1.0% (w/v) ～約4.0% (w/v) である、項目1または2に記載の眼用溶液。

(項目7)

pHが約7.0～約8.0である、項目1または2に記載の眼用溶液。

(項目8)

pHが約7.0～約7.5である、項目1または2に記載の眼用溶液。

(項目9)

前記溶液中の全ナトリウムが、約0.4～約2.0% (w/v) である、項目1または2に記載の眼用溶液。

(項目10)

前記溶液中の全ナトリウムが、約0.9% (w/v) である、項目1または2に記載の眼用溶液。

(項目11)

前記添加剤が、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウム、臭化ベンゾドデシニウム、塩化セチルピリジニウム、クロロブタノール、エチレンジアミン4酢酸 (EDTA)、チメロサル、硝酸フェニル水銀、酢酸フェニル水銀、メチル/プロピルパラベン、フェニルエチルアルコール、安息香酸ナトリウム、プロピオン酸ナトリウム、ソルビン酸、および過ホウ酸ナトリウムから選択される保存剤である、項目2に記載の眼用溶液。

(項目12)

前記添加剤が、カルボボールゲル、カルボキシメチルセルロース、デキストラン、ゼラチン、グリセリン、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、ポリエチレングリコール、ポロキサマー407、ポリソルベート80、プロピレングリコール、ポリビニルアルコール、およびポリビニルピロリドン (polyvinyl pyrrolidone) (ポビドン) から選択される粘性強化剤である、項目2に記載の眼用溶液。

(項目13)

前記添加剤が、酢酸塩、ホウ酸塩、リン酸塩、重炭酸塩、炭酸塩、クエン酸塩、4ホウ酸塩、二リン酸塩、トロメタミン、ヒドロキシエチルモルホリン、およびトリスヒドロキシメチルアミノ-メタン (THAM) から選択される緩衝剤である、項目2に記載の眼用溶液。

(項目14)

前記添加剤が、デキストラン40、デキストラン70、デキストロース、グリセリン、塩

化カリウム、プロピレングリコール、および塩化ナトリウムから選択される張度作用物質である、項目 2 に記載の眼用溶液。

(項目 1 5)

前記添加剤が、ポリソルベート 2 0 および 8 0、ポロキサマー 2 8 2、チロキサポール、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルプロピルセルロース、ポビドン、およびポリビニルアルコールから選択される湿潤剤である、項目 2 に記載の眼用溶液。

(項目 1 6)

前記添加剤が、プロピレングリコール、エチレングリコール、ポリエチレングリコール、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、デキストラン 4 0、デキストラン 7 0、ゼラチン、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポビドン、ペトロラタム、鉱油、およびカルボマーから選択される滑沢剤である、項目 2 に記載の眼用溶液。

(項目 1 7)

前記添加剤が、リン脂質ベースの滑沢剤である、項目 2 に記載の眼用溶液。

(項目 1 8)

ナトリウム対イオンが、塩素イオンである、項目 1 または 2 に記載の眼用溶液。

(項目 1 9)

前記塩素イオンが、H C l 由来である、項目 1 8 に記載の眼用溶液。

(項目 2 0)

項目 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の溶液を罹患した眼に局所的に投与することを含む、炎症または自己免疫状態と関係する眼障害を処置する、方法。

(項目 2 1)

前記眼障害が、眼の前部に影響を及ぼす、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 2 2)

前記眼の前部に影響を及ぼす眼障害が、眼瞼炎、角膜炎；虹彩ルベオース；F u c h s 虹彩異色性虹彩毛様体炎；慢性ブドウ膜炎または前部ブドウ膜炎；結膜炎；アレルギー性結膜炎；乾性角結膜炎；虹彩毛様体炎；虹彩炎；強膜炎；上強膜炎；角膜浮腫；強膜疾患；眼癬痕性類天疱瘡（o c u l a r c i c a t r i c i a l p e m p h i g o i d）；毛様体扁平部炎；P o s n e r S c h l o s s m a n 症候群；ベーチェット病；V o g t - K o y a n a g i - H a r a d a 症候群；結膜浮腫；結膜静脈性うっ血；眼窩周囲蜂巣炎；急性涙嚢炎；非特異性脈管炎；および類肉腫症から選択される、項目 2 1 に記載の方法。

(項目 2 3)

前記眼障害が、眼の後部に影響を及ぼす、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 2 4)

前記眼の後部に影響を及ぼす眼の障害が、黄斑浮腫、嚢胞様黄斑浮腫；網膜虚血；および脈絡膜新血管形成；黄斑変性；糖尿病性網膜症；糖尿病性網膜浮腫；網膜剥離；ブドウ膜炎；汎ブドウ膜炎；脈絡膜炎；上強膜炎；強膜炎；散弾網脈絡膜症；網膜脈管炎；脈絡膜脈管不全；脈絡膜血栓症；視神経新血管形成；および視神経炎から選択される、項目 2 3 に記載の方法。

(項目 2 5)

前記眼障害が、ブドウ膜炎である、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 2 6)

前記眼障害がアレルギー性結膜炎である、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 2 7)

前記眼障害が、乾性角結膜炎である、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 2 8)

前記溶液が毎日 1 ~ 4 回投与される、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 2 9)

前記溶液が 2 日ごとに 1 回投与される、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 3 0)

前記溶液が 4 日ごとに 1 回投与される、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 3 1)

前記溶液が毎週 1 回投与される、項目 2 0 に記載の方法。