

【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1部門第2区分

【発行日】平成17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2005-502392(P2005-502392A)

【公表日】平成17年1月27日(2005.1.27)

【年通号数】公開・登録公報2005-004

【出願番号】特願2002-584692(P2002-584692)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 L 2/18

A 0 1 N 25/00

A 0 1 N 25/02

A 0 1 N 25/30

A 0 1 N 47/44

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/08

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/22

A 6 1 P 27/04

G 0 2 C 13/00

// C 1 1 D 1/68

C 1 1 D 1/70

C 1 1 D 3/26

C 1 1 D 3/48

C 1 1 D 10/02

【F I】

A 6 1 L 2/18

A 0 1 N 25/00 1 0 1

A 0 1 N 25/02

A 0 1 N 25/30

A 0 1 N 47/44

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/08

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/22

A 6 1 P 27/04

G 0 2 C 13/00

C 1 1 D 1/68

C 1 1 D 1/70

C 1 1 D 3/26

C 1 1 D 3/48

C 1 1 D 10/02

【手続補正書】

【提出日】平成17年4月22日(2005.4.22)

【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】**

コンタクトレンズを殺菌するのに有効な組成物であって、
液体水性媒体；
該組成物に接触するコンタクトレンズを殺菌するのに有効な量で、該組成物に存在する殺菌成分；および
界面活性剤として有効な量で、該組成物に存在するビタミン誘導体成分を含んで成る組成物。

【請求項 2】

ビタミン誘導体成分が該液体水性媒体に可溶性である請求項1に記載の組成物。

【請求項 3】

ビタミン誘導体成分が、ビタミンA、ビタミンA2、ビタミンC、ビタミンD1、ビタミンD2、ビタミンD3、ビタミンD4、ビタミンE、ビタミンK1、ビタミンK2、葉酸およびそれらの混合物から選択される1つまたはそれ以上のビタミン誘導体を含有する請求項1に記載の組成物。

【請求項 4】

ビタミン誘導体成分が、少なくとも1つのビタミンE非アニオン誘導体を含有する請求項1に記載の組成物。

【請求項 5】

ビタミン誘導体成分が、1つまたはそれ以上のアミド誘導体を含有する請求項1に記載の組成物。

【請求項 6】

多目的コンタクトレンズケア液剤の形態の請求項1に記載の組成物。

【請求項 7】

該殺菌成分が非酸化性殺菌剤である請求項1に記載の組成物。

【請求項 8】

該殺菌成分が、1つまたはそれ以上のピグアニドを含有する請求項1に記載の組成物。

【請求項 9】

該殺菌成分が、ポリヘキサメチレンピグアニドを含有する請求項1に記載の組成物。

【請求項 10】

ビタミン誘導体成分が、該組成物に接触するコンタクトレンズから付着物を除去するのに少なくとも補助するのに有効な量で存在する請求項1に記載の組成物。

【請求項 11】

ビタミン誘導体成分が、ビタミンE TPGSを含有する請求項1に記載の組成物。

【請求項 12】

ビタミン誘導体成分が、ビタミンE TPGSAを含有する請求項1に記載の組成物。

【請求項 13】

眼内使用に有効な組成物であって、
液体水性媒体；および
界面活性剤として有効な量で、該組成物に存在するビタミン誘導体成分；
を含んで成り、
該組成物が、眼科用に許容され、コンタクトレンズ再湿潤剤、眼内コンタクトレンズ洗浄剤、人工涙組成物、洗眼成分または灌注組成物としての使用に適合した組成物。

【請求項 14】

コンタクトレンズ再湿潤剤の形態の請求項13に記載の組成物。

【請求項 15】

眼内コンタクトレンズ洗浄剤の形態の請求項13に記載の組成物。

【請求項 16】

人工涙組成物の形態の請求項13に記載の組成物。

【請求項 17】

洗眼組成物の形態の請求項13に記載の組成物。

【請求項18】

灌注組成物の形態の請求項13に記載の組成物。

【請求項19】

ステロイド性抗炎症剤、非ステロイド性抗炎症剤、サルファ剤、および低溶解性眼用剤を実質的に含有しない請求項13に記載の組成物。

【請求項20】

ビタミン誘導体成分が、該液体水性媒体に可溶性である請求項13に記載の組成物。

【請求項21】

ビタミン誘導体成分が、ビタミンA、ビタミンA2、ビタミンC、ビタミンD1、ビタミンD2、ビタミンD3、ビタミンD4、ビタミンE、ビタミンK1、ビタミンK2、葉酸およびそれらの混合物から選択される1つまたはそれ以上のビタミン誘導体を含有する請求項13に記載の組成物。

【請求項22】

ビタミン誘導体成分が、少なくとも1つのビタミンE非アニオン誘導体を含有する請求項13に記載の組成物。

【請求項23】

ビタミン誘導体成分が、1つまたはそれ以上のアミド誘導体を含有する請求項13に記載の組成物。

【請求項24】

ビタミン誘導体成分が、ビタミンE TPGSを含有する請求項13に記載の組成物。

【請求項25】

ビタミン誘導体成分が、ビタミンE TPGSAを含有する請求項13に記載の組成物。

【請求項26】

有効量の保存剤成分を含有する請求項13に記載の組成物。

【請求項27】

該保存剤成分が安定化二酸化塩素を含有する請求項26に記載の組成物。

【請求項28】

コンタクトレンズを殺菌する方法であって、コンタクトレンズを殺菌するのに有効な条件において、コンタクトレンズを請求項1,5,6,11または12に記載の組成物に接触させることを含んで成る方法。

【請求項29】

コンタクトレンズを処置する方法であって、コンタクトレンズに必要とされる処置を与えるのに有効な条件において、コンタクトレンズを請求項6に記載の組成物に接触させることを含んで成る方法。

【請求項30】

コンタクトレンズを洗浄する方法であって、タンパク質付着物を有するコンタクトレンズからタンパク質付着物を除去するのに有効な条件において、タンパク質付着物を有するコンタクトレンズを請求項10に記載の組成物に接触させることを含んで成る方法。

【請求項31】

コンタクトレンズを再湿潤する方法であって、コンタクトレンズを再湿潤するのに有効な条件において、コンタクトレンズを請求項16に記載の組成物に接触させることを含んで成る方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0002

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0002】

非イオン界面活性剤は、カチオン、両性およびアニオン界面活性剤と比較して、コンタ

クトレンズポリマーおよび眼組織との比較的少ない有害相互作用により、コンタクトレンズケアおよび眼のケア用途に使用するのが好ましい。非イオン界面活性剤は、コンタクトレンズ多目的液剤に一般に使用されるポリヘキサメチレンピグアニド (PHMB) のようなカチオン殺菌剤との有害な相互作用を最小限にするという点からも好ましい。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0003

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0003】

コンタクトレンズ多目的液剤、再湿潤液剤および眼内洗浄液剤に使用される現在の界面活性剤の例は、米国特許第4836986号に開示されている界面活性剤である。この特許は、使用の際に、好ましい中性または非イオン性界面活性剤が、洗浄特性およびコンディショニング特性を付与し、一般に約15wt%までの量で存在することを開示している。該界面活性剤は、レンズケア溶液に可溶性で、眼組織に非刺激性であり、一般に約12.4~約18.8の親水性/親油性バランス (HLB) を有していなければならない。満足できる非イオン界面活性剤は、脂肪酸のポリエチレングリコールエステル、例えば、ココナツ、ポリソルベート、高級アルカン ($C_{12} \sim C_{18}$) のポリオキシエチレンまたはポリオキシプロピレンエーテルを包含するが、これらに限定されない。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0004】

非イオン界面活性剤の1つの群、付加物の少なくとも約40wt%がポリ(オキシエチレン)であり、分子量約7,500~約27,000を有するエチレンジアミンのポリ(オキシプロピレン)-ポリ(オキシエチレン)付加物は、約0.01~約15wt%の量で使用した場合に、ソフトおよびハードコンタクトレンズの両方の洗浄およびコンディショニングに使用するのに特に有効であることが見出された。この群の界面活性剤についての、CTFA Cosmetic Ingredient Dictionaryでの採用名は、ポロキサミンである。そのような界面活性剤は、BASF Wyandotte Corp., Wyandotte, Mich.から登録商標「Tetronic」として入手可能である。類似した界面活性剤系列は、ポロキサマー系列であり、それらは、BASF Wyandotte Corp., Parsippany, NJ 07054から商標「Pluronic」として入手可能なポリオキシエチレン、ポリオキシプロピレンブロックポリマーである。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0032

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0032】

ビタミンE TPGSは、高水溶性であり、全身的に投与した場合に、生物学的に活性なビタミンEの優れた源である。ビタミンE TPGSは、両親媒性を有し、分子のPEG部分は親水性であり、ビタミンEスクシネート構造は疎水性である。この両親媒性を考慮すれば、ビタミンE TPGSは、表面活性剤(界面活性剤)であり、水ならびに泡中にミセルおよび/または種々の液体結晶相を形成すると考えられる。ビタミンE TPGSは、非イオン界面活性剤のポリエチレングリコール種の1つである。それは、約13.2の親水性/親油性バランス (HLB) を有する。ビタミンE TPGSは、優れた乳化剤および洗浄剤である。水中における臨界ミセル濃度 (CMC) (それより高い界面活性剤濃度でミセルが形成される濃度) は、ビタミンE TPGSについて37 で約0.02w/v%である。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0037

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0037】

エステル構造を有するビタミン系界面活性剤は、多くの場合、本発明の水性組成物、例えば溶液中で、界面活性剤活性を実質的かつ効果的に維持するのに十分に安定である。生物学的に活性なビタミンの生成も生じる他の生体内不安定結合を有する他の種類の界面活性剤を、その界面活性剤が、許容される水準の界面活性剤活性を与えるのに十分な、水溶液中での安定性を有するならば、製造することができる。例えば、アミド結合は、エステル結合より数オーダーの大きさでより加水分解安定性であると推定される。非イオン界面活性剤が好ましい。ある条件では、例えば、殺菌剤の活性が減少せず、眼内安定性および快適性が維持される場合には、カチオン、両性およびアニオン界面活性剤も使用しうる。種々の非イオン界面活性剤種、例えばポリエチレングリコール界面活性剤を、ビタミン先駆物質に基づいて製造し、本発明において使用しうる。現在の有用なビタミン系界面活性剤成分に対応する他の非イオン界面活性剤種は、ポリオキシエチル化直鎖アルコール、ノノキシノール、オクトキシノール、ポリオキシエチル化ドデシルアミン、ソルピタンモノエステル等およびそれらの混合物を包含するが、これらに限定されない。

【手続補正 7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0041

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0041】

本発明のビタミン系界面活性剤は、一般的な非ビタミン界面活性剤、例えば、非イオン、カチオン、アニオンおよび両性非ビタミン界面活性剤と一緒に使用することもできる。ビタミン系界面活性剤は、1つまたはそれ以上の非ビタミン界面活性剤と組み合わせして使用する場合、非イオン非ビタミン界面活性剤と一緒に使用するのが好ましい。

【手続補正 8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0074

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0074】

本発明組成物は緩衝剤を含有してよい。種々の一般的緩衝剤、例えば、燐酸、硼酸、クエン酸、酢酸、ヒシチジン、トリス、ピス-トリス等を使用してよい。硼酸緩衝剤は、硼酸およびその塩、例えば、硼酸ナトリウムまたはカリウムを包含する。溶液中で硼酸またはその塩を生成する四硼酸カリウムまたはメタ硼酸カリウムも使用しうる。硼酸ナトリウム十水和物のような水和塩も使用しうる。燐酸緩衝剤は、燐酸およびその塩、例えば $M_2HP O_4$ および MH_2PO_4 [Mは、NaおよびKのようなアルカリ金属である] を包含する。 $Na_2HP O_4 \cdot 7H_2O$ および $NaH_2PO_4 \cdot H_2O$ のような水和塩も使用しうる。「燐酸」という用語は、溶液中で燐酸またはその塩を生成する化合物も包含する。さらに、前記緩衝剤の有機対イオンも使用しうる。緩衝剤の濃度は一般に約0.05~約2.5w/v%、より好ましくは約0.05~約0.5w/v%である。緩衝剤の種類および量は、配合物が溶液の機能性能基準、例えば界面活性剤安定性、抗微生物有効性および緩衝能を満たすように選択される。緩衝剤は、眼および使用を目的としたあらゆるコンタクトレンズに適合性のpHを与えるようにも選択される。一般に、ヒトの涙のpH7.45に近いpHが極めて有効であるが、約5.0~約8.5、より好ましくは約6.0~約8.0、最も好ましくは約6.8~約7.8の広いpH範囲も許容される。1つの態様において、本発明組成物は約7.0のpHを有する。

【手続補正 9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 1 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 1 3】

ビタミンE TPGSAを含有する他のコンタクトレンズ多目的液剤

0.05w/v% ビタミンE TPGSA (アミド) の濃度は、CMC濃度より高く、従って、多目的液剤中の界面活性剤のFDA条件を満たすので、ただ1つの界面活性剤洗浄剤としてコンタクトレンズ多目的液剤に組み込むのに選択する。多目的液剤の配合を表12に示す。

【表 1 2】

成分	%w/v濃度
ヒドロキシプロピルメチルセルロース	0.15
タウリン	0.05
エデト酸二ナトリウム	0.01
塩化ナトリウム	0.71
塩化カリウム	0.14
ビタミンE TPGSA (アミド)	0.05
ポリヘキサメチレンピグアニド	0.00014
ビスートリス	0.73
PEG 1000	0.10
精製水	100にする量
pH	6.8

【手続補正 10】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 1 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 1 4】

この組成物の抗微生物有効性は、実施例1の液剤の抗微生物有効性と同等かまたはそれより優れている。