

【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 27 年 5 月 28 日 (2015.5.28)

【公表番号】特表 2014-512387 (P2014-512387A)

【公表日】平成 26 年 5 月 22 日 (2014.5.22)

【年通号数】公開・登録公報 2014-027

【出願番号】特願 2014-506535 (P2014-506535)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/08

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/32

【手続補正書】

【提出日】平成 27 年 4 月 7 日 (2015.4.7)

【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】

局所的眼科用複数回用量水性組成物であって、該組成物が：

粘性増強システム；および水を含み、該粘性増強システムが：

i) 消散粘性増強剤であって、該消散粘性増強剤は、ヒトの眼の眼表面への該組成物の投与の際に、増強された粘性を呈するが、次いで、投与の後で、消散し、粘性を徐々に失う、消散粘性増強剤；および

i i) 感熱相転移粘性増強剤であって、該感熱相転移粘性増強剤は、該ヒトの眼の該眼表面への該組成物の投与の際に、より低い粘性を呈するが、次いで、該眼の該眼表面への投与の後で、増強された粘性を呈する、感熱相転移粘性増強剤を含む、局所的眼科用複数回用量水性組成物。

【請求項 2】

治療剤をさらに含む、請求項 1 に記載の眼科用組成物。

【請求項 3】

前記感熱ポリマーは、エチルヒドロキシエチルセルロース、メチルセルロース、ポロキサマー（例えば、ポリオキシエチレン（ポリ（エチレンオキシド））の二つの親水性鎖が側部についたポリオキシプロピレン（ポリ（プロピレンオキシド））の中央の疎水性鎖から構成される非イオン性トリブロックコポリマー）（例えば、B A S F から市販されている P L U R O N I C S（登録商標））、ポリ（ラクチド コ グリコリド）およびポリエチレングリコールから形成されるブロックコポリマー（例えば、A B A トリブロックコポリマー）、ポリ（N - イソプロピルアクリルアミド）および／もしくはポリ（N , N - ジメチルアクリルアミド）のようなアクリルアミド、エチレンオキシドおよびプロピレンオキ

シドをベースにした４官能性ブロックコポリマー（例えば、ＢＡＳＦから市販されているＴＥＴＲＯＮＩＣＳ（登録商標））、またはこれらの任意の組み合わせから成る群から選択される、請求項１もしくは請求項２に記載の眼科用組成物。

【請求項４】

前記消散ポリマーは、カルボキシビニルポリマー、ＨＰＭＣ、ＨＥＣ、ＰＶＰ、ＣＭＣ、ポリビニルアルコール、もしくはこれらの任意の組み合わせを含む群から選択される、請求項１、請求項２もしくは請求項３に記載の眼科用組成物。

【請求項５】

前記消散粘性増強剤は、前記組成物にさらなる粘性を提供し、該さらなる粘性は、少なくとも１０ｃｐであるが、１００ｃｐ以下である、請求項１から４のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項６】

前記組成物中の前記消散粘性増強剤の濃度が、少なくとも約０．１０ｗ／ｖ％であるが、約２．５ｗ／ｖ％以下である、請求項１から５のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項７】

前記組成物中の前記感熱粘性剤の濃度が、少なくとも約０．８０ｗ／ｖ％であるが、１０ｗ／ｖ％以下である、請求項１から６のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項８】

前記感熱粘性剤は、粘性を実質的に増大させ、好ましくは、上昇させられた温度において、ゲル化するか、もしくは少なくとも部分的にゲル化し、該上昇させられた温度は、室温（すなわち、２５）～ヒト体温（すなわち、３７）、より典型的に２９～３５、さらにより典型的に３２～３４にある、請求項１から７のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項９】

局所的眼科用複数回用量水性組成物であって、該組成物が：

治療的有効量の治療剤；

粘性増強システム；および水を含み、該粘性増強システムが：

i) 消散粘性増強剤であって、該消散粘性増強剤は、ヒトの眼の眼表面への該組成物の投与の際に、増強された粘性を呈するが、次いで、投与の後で、消散し、粘性を徐々に失い、該消散粘性増強剤はポリマー性である、消散粘性増強剤；および

i i) 感熱相転移粘性増強剤であって、該感熱相転移粘性増強剤は、該ヒトの眼の該眼表面への該組成物の投与の際に、より低い粘性を呈するが、次いで、該眼の該眼表面への投与の後で、増強された粘性を呈し、該感熱相転移粘性増強剤はポリマー性である、感熱相転移粘性増強剤

を含む、局所的眼科用複数回用量水性組成物。

【請求項１０】

前記感熱ポリマーは、エチルヒドロキシエチルセルロース、メチルセルロース、ポロキサマー（例えば、ポリオキシエチレン（ポリ（エチレンオキシド））の二つの親水性鎖が側部についたポリオキシプロピレン（ポリ（プロピレンオキシド））の中央の疎水性鎖から構成される非イオン性トリブロックコポリマー）（例えば、ＢＡＳＦから市販されているＰＬＵＲＯＮＩＣＳ（登録商標））、ポリ（ラクチド コ グリコリド）およびポリエチレングリコールから形成されるブロックコポリマー（例えば、ＡＢＡトリブロックコポリマー）、ポリ（Ｎ－イソプロピルアクリルアミド）および／もしくはポリ（Ｎ，Ｎ－ジメチルアクリルアミド）のようなアクリルアミド、エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドをベースにした４官能性ブロックコポリマー（例えば、ＢＡＳＦから市販されているＴＥＴＲＯＮＩＣＳ（登録商標））、またはこれらの任意の組み合わせから成る群から選択される、請求項９に記載の眼科用組成物。

【請求項１１】

前記消散ポリマーは、カルボキシビニルポリマー、ＨＰＭＣ、ＨＥＣ、ＣＭＣ、もしくはこれらの任意の組み合わせから成る群から選択される、請求項９もしくは請求項１０に記

載の眼科用組成物。

【請求項 1 2】

前記消散粘性増強剤は、前記組成物にさらなる粘性を提供し、該さらなる粘性は、少なくとも 10 c p であるが、100 c p 以下である、請求項 9 から請求項 1 1 のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項 1 3】

前記組成物中の前記消散粘性増強剤の濃度が、少なくとも約 0.10 w / v % であるが、約 2.5 w / v % 以下である、請求項 9 から請求項 1 2 のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項 1 4】

前記組成物中の前記感熱粘性剤の濃度が、少なくとも約 0.80 w / v % であるが、10 w / v % 以下である、請求項 9 から請求項 1 3 のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項 1 5】

前記感熱粘性剤は、粘性を実質的に増大させ、好ましくは、上昇させられた温度において、ゲル化するか、もしくは少なくとも部分的にゲル化し、該上昇させられた温度は、室温（すなわち、25）～ヒト体温（すなわち、37）、より典型的に 29 ～ 35、さらにより典型的に 32 ～ 34 にある、請求項 9 から請求項 1 4 のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項 1 6】

前記治療剤は、抗緑内障剤、抗血管新生剤；抗感染剤；抗炎症剤；成長因子；免疫抑制剤；および抗アレルギー剤から成る群から選択される、請求項 1 から 1 5 のいずれかに記載の眼科用組成物。

【請求項 1 7】

請求項 1 から 1 6 のいずれかに記載の眼科用組成物であって、該眼科用組成物は、哺乳類の眼へ局所的に投与されることを特徴とする、眼科用組成物。

【請求項 1 8】

前記哺乳類は、ヒトである、請求項 1 7 に記載の眼科用組成物。

【請求項 1 9】

前記組成物は、該組成物の点眼物を点眼器から前記眼へ放出することによって投与されることを特徴とする、請求項 1 7 もしくは請求項 1 8 に記載の眼科用組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0010

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0010】

本発明はまた、眼科用組成物を哺乳類の眼へ局所的に投与する方法に関する。この組成物は、上記または本明細書中の他の部分で説明されているように可能である。この哺乳類は、典型的に、ヒトであり得る。好ましい実施形態において、この組成物は、点眼器から眼へ組成物の点眼物を放つことによって投与される。

本発明の好ましい実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目 1)

局所的眼科用複数回用量水性組成物であって、該組成物が：

粘性増強システム；および水を含み、該粘性増強システムが：

i) 消散粘性増強剤であって、該消散粘性増強剤は、ヒトの眼の眼表面への該組成物の投与の際に、増強された粘性を呈するが、次いで、投与の後で、消散し、粘性を徐々に失う、消散粘性増強剤；および

i i) 感熱相転移粘性増強剤であって、該感熱相転移粘性増強剤は、該ヒトの眼の該眼表面への該組成物の投与の際に、より低い粘性を呈するが、次いで、該眼の該眼表面への

投与の後で、増強された粘性を呈する、感熱相転移粘性増強剤を含む、局所的眼科用複数回用量水性組成物。

(項目2)

治療剤をさらに含む、項目1に記載の眼科用組成物。

(項目3)

前記感熱ポリマーは、エチルヒドロキシエチルセルロース、メチルセルロース、ポロキサマー（例えば、ポリオキシエチレン（ポリ（エチレンオキシド））の二つの親水性鎖が側部についたポリオキシプロピレン（ポリ（プロピレンオキシド））の中央の疎水性鎖から構成される非イオン性トリブロックコポリマー）（例えば、BASFから市販されているPLURONICS（登録商標））、ポリ（ラクチド コ グリコリド）およびポリエチレングリコールから形成されるブロックコポリマー（例えば、ABAトリブロックコポリマー）、ポリ（N-イソプロピルアクリルアミド）および/もしくはポリ（N,N-ジメチルアクリルアミド）のようなアクリルアミド、エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドをベースにした4官能性ブロックコポリマー（例えば、BASFから市販されているTETRONICS（登録商標））、またはこれらの任意の組み合わせから成る群から選択される、項目1もしくは項目2に記載の眼科用組成物。

(項目4)

前記消散ポリマーは、カルボキシビニルポリマー、HPMC、HEC、PVP、CMC、ポリビニルアルコール、もしくはこれらの任意の組み合わせを含む群から選択される、項目1、項目2もしくは項目3に記載の眼科用組成物。

(項目5)

前記消散粘性増強剤は、前記組成物にさらなる粘性を提供し、該さらなる粘性は、少なくとも10cpであるが、100cp以下である、前記項目のいずれかに記載の眼科用組成物。

(項目6)

前記組成物中の前記消散粘性増強剤の濃度が、少なくとも約0.10w/v%であるが、約2.5w/v%以下である、前記項目のいずれかに記載の眼科用組成物。

(項目7)

前記組成物中の前記感熱粘性剤の濃度が、少なくとも約0.80w/v%であるが、10w/v%以下である、前記項目のいずれかに記載の眼科用組成物。

(項目8)

前記感熱粘性剤は、粘性を実質的に増大させ、好ましくは、上昇させられた温度において、ゲル化するか、もしくは少なくとも部分的にゲル化し、該上昇させられた温度は、室温（すなわち、25）～ヒト体温（すなわち、37）、より典型的に29～35、さらにより典型的に32～34にある、前記項目のいずれかに記載の眼科用組成物。

(項目9)

局所的眼科用複数回用量水性組成物であって、該組成物が：

治療的有効量の治療剤；

粘性増強システム；および水を含み、該粘性増強システムが：

i) 消散粘性増強剤であって、該消散粘性増強剤は、ヒトの眼の眼表面への該組成物の投与の際に、増強された粘性を呈するが、次いで、投与の後で、消散し、粘性を徐々に失い、該消散粘性増強剤はポリマー性である、消散粘性増強剤；および

ii) 感熱相転移粘性増強剤であって、該感熱相転移粘性増強剤は、該ヒトの眼の該眼表面への該組成物の投与の際に、より低い粘性を呈するが、次いで、該眼の該眼表面への投与の後で、増強された粘性を呈し、該消散粘性増強剤はポリマー性である、感熱相転移粘性増強剤

を含む、局所的眼科用複数回用量水性組成物。

(項目10)

前記感熱ポリマーは、エチルヒドロキシエチルセルロース、メチルセルロース、ポロキサマー（例えば、ポリオキシエチレン（ポリ（エチレンオキシド））の二つの親水性鎖が側

部についたポリオキシプロピレン（ポリ（プロピレンオキシド））の中央の疎水性鎖から構成される非イオン性トリブロックコポリマー（例えば、BASFから市販されているPLURONICS（登録商標））、ポリ（ラクチド コ グリコリド）およびポリエチレングリコールから形成されるブロックコポリマー（例えば、ABAトリブロックコポリマー）、ポリ（N - イソプロピルアクリルアミド）および／もしくはポリ（N , N - ジメチルアクリルアミド）のようなアクリルアミド、エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドをベースにした4官能性ブロックコポリマー（例えば、BASFから市販されているTETRONICS（登録商標））、またはこれらの任意の組み合わせから成る群から選択される、項目9に記載の眼科用組成物。

（項目11）

前記消散ポリマーは、カルボキシビニルポリマー、HPMC、HEC、CMC、もしくはこれらの任意の組み合わせから成る群から選択される、項目9もしくは項目10に記載の眼科用組成物。

（項目12）

前記消散粘性増強剤は、前記組成物にさらなる粘性を提供し、該さらなる粘性は、少なくとも10cpであるが、100cp以下である、項目9から項目11のいずれかに記載の眼科用組成物。

（項目13）

前記組成物中の前記消散粘性増強剤の濃度が、少なくとも約0.10w/v%であるが、約2.5w/v%以下である、項目9から項目12のいずれかに記載の眼科用組成物。

（項目14）

前記組成物中の前記感熱粘性剤の濃度が、少なくとも約0.80w/v%であるが、10w/v%以下である、項目9から項目13のいずれかに記載の眼科用組成物。

（項目15）

前記感熱粘性剤は、粘性を実質的に増大させ、好ましくは、上昇させられた温度において、ゲル化するか、もしくは少なくとも部分的にゲル化し、該上昇させられた温度は、室温（すなわち、25）～ヒト体温（すなわち、37）、より典型的に29～35、さらにより典型的に32～34にある、項目9から項目14のいずれかに記載の眼科用組成物。

（項目16）

前記治療剤は、抗緑内障剤、抗血管新生剤；抗感染剤；抗炎症剤；成長因子；免疫抑制剤；および抗アレルギー剤から成る群から選択される、前記項目のいずれかに記載の眼科用組成物。

（項目17）

前記項目のいずれかに記載の眼科用組成物を投与する方法であって、該方法は：

該眼科用組成物を哺乳類の眼へ局所的に投与する工程を含む、前記項目のいずれかに記載の眼科用組成物を投与する方法。

（項目18）

前記哺乳類は、ヒトである、項目17に記載の方法。

（項目19）

前記投与する工程は、前記組成物の点眼物を点眼器から前記眼へ放つ工程を含む、項目17もしくは項目18に記載の方法。