

【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20年5月15日 (2008.5.15)

【公表番号】特表2007-532544(P2007-532544A)

【公表日】平成19年11月15日 (2007.11.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-044

【出願番号】特願2007-507367(P2007-507367)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/131 (2006.01)

A 0 1 N 33/04 (2006.01)

A 0 1 P 3/00 (2006.01)

A 0 1 N 47/44 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/255 (2006.01)

G 0 2 C 13/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/131

A 0 1 N 33/04

A 0 1 P 3/00

A 0 1 N 47/44

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/18

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 31/255

G 0 2 C 13/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年3月27日 (2008.3.27)

【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

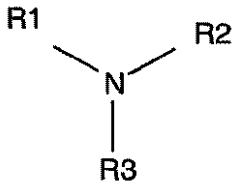
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

コンタクトレンズ用の多目的溶液であって、
水性液体媒質、
約 0.1 ppm ~ 約 10 ppm の以下の式：

【化 1】



〔式中、R 1 は C₁₋₃ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H または -CH₃ である〕

を有するアルキルアミン、および

(a) 該アルキルアミンの抗微生物活性を中和することなく該アルキルアミンを該水溶液に可溶性にするのに、および (b) 該溶液に接触するコンタクトレンズを洗浄するのに有効な量で該溶液中に存在する非イオン性界面活性剤を含んでなる、コンタクトレンズ用の多目的溶液。

【請求項 2】

アルキルアミンは、ミリスチルアミンおよびセチルアミンからなる群から選択される、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 3】

非イオン性界面活性剤は、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマーである、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 4】

セルロース誘導体およびそれらの混合物からなる群から選択される粘度誘発成分を、全溶液の約 0.05 % (w / v) ~ 約 5.0 % (w / v) の範囲でさらに含んでなる、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 5】

全溶液の 0.05 % (w / v) 未満の量でキレート化成分をさらに含んでなる、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 6】

該溶液に所望の張度を与えるのに有効な量の張度成分をさらに含んでなる、請求項 1 に記載の溶液。

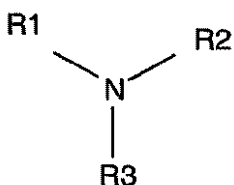
【請求項 7】

該溶液の pH を生理学的に許容される範囲に維持するのに有効な量の緩衝剤成分をさらに含んでなる、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 8】

コンタクトレンズケア用の多目的溶液であって、水性液体媒質、以下の式：

【化 2】



〔式中、R 1 は C₁₋₃ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H または -CH₃ である〕

を有するアルキルアミンを含んでなる約 0.1 ppm ~ 約 10 ppm の該溶液に接触するコンタクトレンズを消毒するのに有効な量の第一抗微生物成分、

(a) 該アルキルアミンの抗微生物活性を中和することなく該アルキルアミンを該水溶液に可溶性にするのに、および (b) 該溶液に接触するコンタクトレンズを洗浄するのに有

効な量で該溶液中に存在する非イオン性界面活性剤、
該溶液のpHを生理学的に許容される範囲に維持するのに有効な量の緩衝剤成分、
全溶液の約0.05%(w/v)～約5.0%(w/v)の範囲の、セルロース誘導体およびそ
れらの混合物からなる群から選択される粘度誘発成分、
全溶液の0.05%(w/v)未満の量のキレート化成分、および
該溶液に所望の張度を与えるのに有効な量の張度成分
を含んでなる、コンタクトレンズケア用の多目的溶液。

【請求項9】

アルキルアミンは、ミリスチルアミンおよびセチルアミンからなる群から選択される、
請求項8に記載の溶液。

【請求項10】

非イオン性界面活性剤は、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリ
マーである、請求項8に記載の溶液。

【請求項11】

非イオン性界面活性剤は、ポリ(オキシエチレン)-ポリ(オキシプロピレン)ブロックコ
ポリマーおよびそれらの混合物から選択され、約0.01%(w/v)～約1.0%(w/v)
の範囲の量で存在する請求項8に記載の多目的溶液。

【請求項12】

非イオン性界面活性剤は、約0.01%(w/v)～約1.0%(w/v)の範囲の量で存在
する、請求項8に記載の多目的溶液。

【請求項13】

緩衝剤成分は、約0.01%(w/v)～約1%(w/v)の範囲の量で存在する、請求項
8に記載の多目的溶液。

【請求項14】

張度成分は、塩化ナトリウムおよび塩化カリウムの組合せを含有し、約0.4%(w/v)
～約1.5%(w/v)の範囲で存在する、請求項8に記載の多目的溶液。

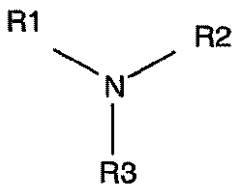
【請求項15】

キレート化成分はEDTAである、請求項8に記載の多目的溶液。

【請求項16】

コンタクトレンズ用の多目的溶液であって、
水性液体媒質、
以下の式：

【化3】



〔式中、R1はC₁₃～C₁₇アルキルであり、R2およびR3は、互いに独立してHまたは
-CH₃である〕

を有するアルキルアミンを含んでなる約0.1ppm～約10ppmの第一抗微生物剤、
第二抗微生物剤、

該アルキルアミンの抗微生物活性を中和することなく該アルキルアミンを該水溶液に可溶
性にするのに有効な量で該溶液中に存在する非イオン性界面活性剤、および

眼の組織細胞膜を保護するのに有効な量のタウリン
を含んでなる、コンタクトレンズ用の多目的溶液。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

〔式中、R₁はC₁₃～₁₇アルキルであり、R₂およびR₃は、互いに独立してHまたは-CH₃である〕

を有するアルキルアミンを含有する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0015

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0015】

本発明の別の実施態様において、R₁はC₁₆～₁₇アルキルであり、R₂およびR₃は、互いに独立してHまたは-CH₃である。例として、R₁がC₁₄であり、R₂およびR₃がHである場合、該アルキルアミンはミリスチルアミンであり、およびR₁がC₁₆であり、R₂およびR₃がHである場合、該アルキルアミンはセチルアミンである。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0019

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0019】

〔式中、R₁はC₁₃～₁₇アルキルであり、R₂およびR₃は、互いに独立してHまたは-CH₃である〕

を有するアルキルアミンは、真菌および特定の細菌に対する高い活性を有することが見出された。このような適用は、このようなアルキルアミンの水溶性の欠落によって妨げられている。以下に記載した要因に基づいて、上記アルキルアミンは、少なくとも約0.1 ppmまたは約0.3 ppmから、少なくとも約7.5 ppmまたは10 ppmまでの範囲の量で存在し得る。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0035

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0035】

〔式中、R₁はC₁₃～₁₇アルキルであり、R₂およびR₃は、互いに独立してHまたは-CH₃である〕

を有するアルキルアミン、

該組成物に接触するコンタクトレンズを洗浄するのに有効な量の界面活性剤(通常、非イオン性界面活性剤)、

該組成物のpHを生理学的に許容される範囲に維持するのに有効な量のホウ酸緩衝剤成分、

有効量の粘度誘発成分、および

有効量の張度成分を含んでなる。本組成物は、好適には有効量の、より好適には0.05%(w/v)未満の範囲の、キレート化成分または金属イオン封鎖成分を含有する。本発明の溶液および処方溶液中に含有される各成分は、用いる濃度において、通常、眼科的に許容される。さらに、(アルキルアミンの場合、上記のように陰イオン性界面活性剤と組み合わせる)本溶液中に含有される各々の成分は、用いる濃度において、通常、水性液体媒質中に溶解する。また、該溶液は、必要に応じて、該溶液の残りのものと共同して、該組成物に接触するコンタクトレンズを消毒するのに有効な量のさらなる抗微生物成分を含有

し得る。

【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】

現在の有用な抗微生物成分は、コンタクトレンズを汚染するような細菌または微生物との化学的または生理化学的相互作用によってそれらの抗微生物活性を引き出す化学物質を包含する。適当なさらなる抗微生物成分は、眼科用途に一般に使用される物質であり、下記のを包含するがそれらに限定されない：眼科用途に使用される第四級アンモニウム塩、例えばポリ〔（ジメチルイミノ）-2-ブテン-1,4-ジイルクロリド〕、-〔4-〔トリス（2-ヒドロキシエチル）アンモニオ】-2-ブテニル〕- -〔トリス（2-ヒドロキシエチル）アンモニオ】-ジクロリド（化学登録番号75345-27-6、Onyx Corporationからポリクオタニウム（登録商標）1として入手可能）、ハロゲン化ベンザルコニウム、およびピグアニド、例えば、アレキシジンの塩、アレキシジン遊離塩基、クロルヘキシジンの塩、ヘキサメチレンピグアニドおよびそれらのポリマー、およびそれらの塩、抗微生物ポリペプチド、二酸化塩素先駆物質等、およびそれらの混合物。一般に、ヘキサメチレンピグアニドポリマー（PHMB）は、ポリアミノプロピルピグアニド（PAPB）とも称され、約100,000までの分子量を有する。このような化合物は、既知であり、Ogunbiyiらの米国特許第4759595号に開示される（その開示は、全体として本明細書に参照により組み込まれる）。

【手続補正 7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0080

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0080】

〔式中、R1はC₁₋₃₋₁₇アルキルであり、R2およびR3は、互いに独立してHまたは-CH₃である〕

を有するアルキルアミンの抗微生物活性は、1以上の他のタイプの抗微生物剤を添加した場合、さらに強化され得る。

【手続補正 8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0087

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0087】

〔式中、R1はC₁₋₃₋₁₇アルキルであり、R2およびR3は、互いに独立してHまたは-CH₃である〕

を有する水不溶性アルキルアミンは、界面活性剤によって、抗微生物活性を中和されることがなく、水溶液中に溶解し得る。抗微生物活性が有意に中和される最大の上記界面活性剤：抗微生物剤比は、界面活性剤の疎水性／親水性および抗微生物剤の量に応じて変動する。少なくとも一つのアルキル鎖を有する通常の界面活性剤、例えば、Tween 80およびTPGSに関して、アルキルアミン濃度が10 ppm以下である場合、この最大の界面活性剤：抗微生物剤比は、約7～20である。当業者は、本明細書に含まれる記載に基づいて、他の界面活性剤系についての最大の界面活性剤：アルキルアミン比を決定することができる。

【手続補正 9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 9 8

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 9 8 】

〔式中、R 1 は C₁₃ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H または -CH₃ である〕

を有するアルキルアミンは、他のタイプの第四級アンモニウムまたは第三級アミンよりも、顕著に低いコンタクトレンズ取り込みを有する。結果として、眼の刺激は、顕著に低減され得る。

【手続補正 1 0】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 0 1 0 6

【補正方法】 変更

【補正の内容】

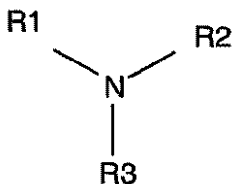
【 0 1 0 6 】

種々の特定実施例および態様に関して本発明を説明したが、本発明はそれらに限定されるものではなく、請求の範囲内の変更を加えて実施し得るものと理解される。

本発明の好適な実施態様には、以下のものが含まれる。

〔 1 〕 多目的溶液であって、
水性液体媒質、
以下の式：

〔化 1〕



〔式中、R 1 は C₁₃ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H または -CH₃ である〕

を有するアルキルアミン、および

該溶液に接触するコンタクトレンズを洗浄するのに有効な量の非イオン性界面活性剤を含んでなる、多目的溶液。

〔 2 〕 アルキルアミンは、ミリスチルアミンおよびセチルアミンからなる群から選択される、上記〔 1 〕に記載の溶液。

〔 3 〕 非イオン性界面活性剤は、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマーである、上記〔 1 〕に記載の溶液。

〔 4 〕 第二抗微生物成分をさらに含んでなる、上記〔 1 〕に記載の溶液。

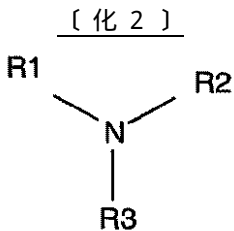
〔 5 〕 セルロース誘導体およびそれらの混合物からなる群から選択される粘度誘発成分を、全溶液の少なくとも約 0.05 % (w / v) から約 5.0 % (w / v) までの範囲でさらに含んでなる、上記〔 1 〕に記載の溶液。

〔 6 〕 全溶液の 0.05 % (w / v) 未満の量でキレート化成分をさらに含んでなる、上記〔 1 〕に記載の溶液。

〔 7 〕 該溶液に所望の張度を与えるのに有効な量の張度成分をさらに含んでなる、上記〔 1 〕に記載の溶液。

〔 8 〕 該溶液の pH を生理学的に許容される範囲に維持するのに有効な量の緩衝剤成分をさらに含んでなる、上記〔 1 〕に記載の溶液。

〔 9 〕 コンタクトレンズケア用の多目的溶液であって、
水性液体媒質、
以下の式：



〔式中、R 1 は C₁ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H または -CH₃ である〕

を有するアルキルアミンを含んでなる、該溶液に接触するコンタクトレンズを消毒するの
に有効な量の第一抗微生物成分、

該溶液に接触するコンタクトレンズを洗浄するのに有効な量の非イオン性界面活性剤、

該溶液の pH を生理学的に許容される範囲に維持するのに有効な量の緩衝剤成分、

全溶液の少なくとも約 0.05 % (w / v) から約 5.0 % (w / v) までの範囲の、セルロー
ス誘導体およびそれらの混合物からなる群から選択される粘度誘発成分、

全溶液の 0.05 % (w / v) 未満の量のキレート化成分、および

該溶液に所望の張度を与えるのに有効な量の張度成分

を含んでなる、コンタクトレンズケア用の多目的溶液。

〔 10 〕 アルキルアミンは、ミリスチルアミンおよびセチルアミンからなる群から選択
される、上記〔 9 〕に記載の溶液。

〔 11 〕 非イオン性界面活性剤は、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロッ
クコポリマーである、上記〔 9 〕に記載の溶液。

〔 12 〕 第二抗微生物成分をさらに含んでなる、上記〔 9 〕に記載の多目的溶液。

〔 13 〕 抗微生物成分は、ピグアニド、ピグアニドポリマー、モノマー第四級アンモニ
ウム化合物、それらの塩およびそれらの混合物からなる群から選択される、上記〔 12 〕
に記載の多目的溶液。

〔 14 〕 第二抗微生物成分は、約 0.1 ppm ~ 約 3 ppm の範囲の量で存在する、上
記〔 12 〕に記載の多目的溶液。

〔 15 〕 非イオン性界面活性剤は、ポリ(オキシエチレン)-ポリ(オキシプロピレン)ブ
ロックコポリマーおよびそれらの混合物から選択され、少なくとも約 0.01 % (w / v)
から約 1.0 % (w / v) までの範囲の量で存在する上記〔 9 〕に記載の多目的溶液。

〔 16 〕 非イオン性界面活性剤は、少なくとも約 0.01 % (w / v) から約 1.0 % (w
/ v) までの範囲の量で存在する、上記〔 9 〕に記載の多目的溶液。

〔 17 〕 緩衝剤成分はホウ酸を含有する、上記〔 9 〕に記載の多目的溶液。

〔 18 〕 緩衝剤成分は、少なくとも約 0.01 % (w / v) から約 1 % (w / v) までの範
囲の量で存在する、上記〔 9 〕に記載の多目的溶液。

〔 19 〕 粘度誘発成分は、ヒドロキシプロピルメチルセルローズである、上記〔 9 〕に
記載の多目的溶液。

〔 20 〕 張度成分は、塩化ナトリウムおよび塩化カリウムの組合せを含有し、少なくと
も約 0.4 % (w / v) から約 1.5 % (w / v) までの範囲で存在する、上記〔 9 〕に記載の
多目的溶液。

〔 21 〕 キレート化成分は EDTA である、上記〔 9 〕に記載の多目的溶液。

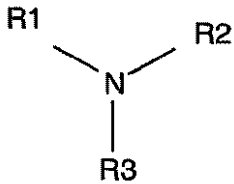
〔 22 〕 タウリンをさらに含んでなる、上記〔 9 〕に記載の多目的溶液。

〔 23 〕 コンタクトレンズ装用中の眼の組織細胞膜の完全性を維持する方法であって、
コンタクトレンズを、

水溶液であって、

約 0.1 ppm ~ 約 10 ppm の以下の式：

〔化 3 〕



〔式中、R 1 は C₁ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H または -CH₃ である〕

を有するアルキルアミン、および

該アルキルアミンを該水溶液に可溶性にするのに有効な量の非イオン性界面活性剤を含んでなる、水溶液

に接触させることを含む、方法。

〔24〕 アルキルアミンは、ミリスチルアミンおよびセチルアミンからなる群から選択される、上記〔23〕に記載の消毒法。

〔25〕 非イオン性界面活性剤は、ポリオキシプロピレン-ポリオキシエチレンブロックコポリマーである、上記〔23〕に記載の消毒法。

〔26〕 水溶液は、第二抗微生物剤、粘度誘発剤、キレート化剤、緩衝剤、タウリンおよび張度成分からなる群から選択される成分をさらに含んでなる、上記〔23〕に記載の消毒法。

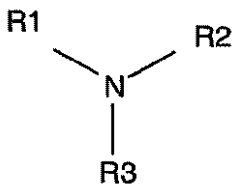
〔27〕 コンタクトレンズ装用中に眼の組織細胞膜の完全性を維持する方法であって、使用者の眼の中に配置されたコンタクトレンズを、

等張水溶液であって、

水性液体媒質、

以下の式：

〔化4〕



〔式中、R 1 は C₁ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H または -CH₃ である〕

を有するアルキルアミンを含んでなる、該溶液に接触するコンタクトレンズを消毒するのに有効な量の第一抗微生物成分、

眼の組織細胞膜を保護するのに有効な量のタウリン、

該溶液に接触するコンタクトレンズを洗浄するのに有効な量の非イオン性界面活性剤、

該溶液の pH を生理学的に許容される範囲に維持するのに有効な量の緩衝剤成分、

全溶液の少なくとも約 0.05% (w/v) から約 5.0% (w/v) までの範囲の、セルロース誘導体およびそれらの混合物からなる群から選択される粘度誘発成分、

全溶液の 0.05% (w/v) 未満の量のキレート化成分、および

該溶液に所望の張度を与えるのに有効な量の張度成分

を含んでなる、等張水溶液

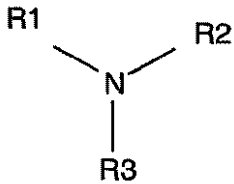
に接触させることを含む、方法。

〔28〕 眼の組織の損傷を緩和する方法であって、使用者の眼に、

水性液体媒質であって、

以下の式：

〔化5〕



〔式中、R 1 は C₁₃ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H または -CH₃ である〕

を有するアルキルアミンを含んでなる、該溶液に接触するコンタクトレンズを消毒するの
に有効な量の第一抗微生物成分、

眼の組織細胞膜を保護するのに有効な量のタウリン、および

該溶液に接触するコンタクトレンズを洗浄するのに有効な量の非イオン性界面活性剤

を含んでなる、水性液体媒質

を投与することを含む、方法。

〔29〕 アルキルアミンは、ミリスチルアミンおよびセチルアミンからなる群から選択
される、上記〔28〕に記載の方法。

〔30〕 投与工程を、水性液体媒質が一時的に使用者の眼の中に留まるように行う、上
記〔28〕に記載の方法。

〔31〕 投与工程を、ソフトコンタクトレンズおよび気体透過性ハードコンタクトレン
ズの少なくとも1つの中に水性液体媒質の取り込みが達成されるように行う、上記〔28
〕に記載の方法。

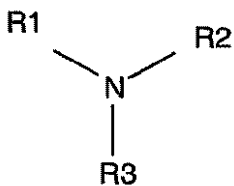
〔32〕 水性液体媒質は、第二抗微生物成分をさらに含んでなる、上記〔28〕に記載
の方法。

〔33〕 多目的溶液であって、

水性液体媒質、

以下の式：

〔化6〕



〔式中、R 1 は C₁₃ ~ C₁₇ アルキルであり、R 2 および R 3 は、互いに独立して H また
は -CH₃ である〕

を有するアルキルアミンを含んでなる第一抗微生物剤、

第二抗微生物剤、

該溶液に接触するコンタクトレンズを洗浄するのに有効な量の非イオン性界面活性剤、お
よび

眼の組織細胞膜を保護するのに有効な量のタウリン

を含んでなる、多目的溶液。