

【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1月5日 (2012.1.5)

【公表番号】特表2010-511729(P2010-511729A)

【公表日】平成22年4月15日 (2010.4.15)

【年通号数】公開・登録公報2010-015

【出願番号】特願2009-540451(P2009-540451)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/569 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/57 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

G 0 2 C 13/00 (2006.01)

A 6 1 F 9/007 (2006.01)

C 0 7 J 7/00 (2006.01)

C 0 7 J 1/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/569

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 31/57

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/00

A 6 1 K 9/08

G 0 2 C 13/00

A 6 1 F 9/00 5 5 0

C 0 7 J 7/00

C 0 7 J 1/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年11月17日 (2010.11.17)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 1 6 】

(発明の要旨)

本発明は、眼の状態（特に、ドライアイ）を処置するための組成物送達選択および方法に関する。ここで上記組成物は、治療有効量のプロゲスターゲンと少なくとも 1 種の薬学的に受容可能なキャリアを含む。このような状態はまた、レーザーまたは他のタイプの眼の外科手術から生じる効果を含み得る。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目 1)

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、
治療有効量のプロゲスターゲン；および

薬学的に受容可能なキャリア；

を含み、ここで該組成物は、眼の眼瞼部分に適用される、組成物。

(項目2)

前記プロゲスターゲンはプロゲステロンである、項目1に記載の組成物。

(項目3)

前記プロゲスターゲンは、プロゲステロンの誘導体である、項目1に記載の組成物。

(項目4)

前記プロゲスターゲンは合成プロゲスターゲンである、項目1に記載の組成物。

(項目5)

前記プロゲスターゲンは、酢酸メドロキシプロゲステロンである、項目1に記載の組成物。

(項目6)

前記プロゲスターゲンはノルエチンドロンである、項目1に記載の組成物。

(項目7)

前記プロゲスターゲンは酢酸ノルエチンドロンである、項目1に記載の組成物。

(項目8)

前記プロゲスターゲンは酢酸メゲストロールである、項目1に記載の組成物。

(項目9)

前記プロゲスターゲンは17- α -ヒドロキシプロゲステロンカプロエートである、項目1に記載の組成物。

(項目10)

前記プロゲスターゲンはノルゲストレルである、項目1に記載の組成物。

(項目11)

前記組成物は、約25mg～約500mgの量の量で適用される、項目1に記載の組成物。

(項目12)

前記組成物は、約100mg～約400mgの量の量で適用される、項目1に記載の組成物。

(項目13)

前記組成物は、約160mgの量の量で適用される、項目1に記載の組成物。

(項目14)

前記プロゲスターゲンは、約2%～約30%の濃度で存在する、項目1に記載の組成物。

(項目15)

前記プロゲスターゲンは、約10%～約30%の濃度で存在する、項目1に記載の組成物。

(項目16)

前記プロゲスターゲンは、約15%～約25%の濃度で存在する、項目1に記載の組成物。

(項目17)

前記プロゲスターゲンは約15%の濃度で存在する、項目1に記載の組成物。

(項目18)

前記プロゲステロンは、約2%～約30%の濃度で存在する、項目2に記載の組成物。

(項目19)

前記プロゲステロンは、約10%～約30%の濃度で存在する、項目2に記載の組成物。

(項目20)

前記プロゲステロンは、約15%～約25%の濃度で存在する、項目2に記載の組成物。

(項目21)

前記プロゲステロンは、約15%の濃度で存在する、項目2に記載の組成物。

(項目22)

前記組成物は1日に1回適用される、項目1に記載の組成物。

(項目23)

前記組成物は、1日に少なくとも2回適用される、項目1に記載の組成物。

(項目24)

前記組成物の約50mg～約100mgが、各々の眼に適用される、項目1に記載の組成物。

(項目25)

前記組成物の約80mgが、各々の眼に適用される、項目1に記載の組成物。

(項目26)

前記薬学的に受容可能なキャリアはクリームである、項目1に記載の組成物。

(項目27)

前記薬学的に受容可能なキャリアは軟膏である、項目1に記載の組成物。

(項目28)

前記薬学的に受容可能なキャリアはゲルである、項目1に記載の組成物。

(項目29)

前記薬学的に受容可能なキャリアは液剤である、項目1に記載の組成物。

(項目30)

前記薬学的に受容可能なキャリアはエマルジョンである、項目1に記載の組成物。

(項目31)

前記薬学的に受容可能なキャリアはローションである、項目1に記載の組成物。

(項目32)

前記薬学的に受容可能なキャリアは実質的に密封性である、項目1に記載の組成物。

(項目33)

透過性促進剤をさらに含む、項目1に記載の組成物。

(項目34)

日焼け止め剤をさらに含む、項目1に記載の組成物。

(項目35)

保湿剤をさらに含む、項目1に記載の組成物。

(項目36)

ビタミンをさらに含む、項目1に記載の組成物。

(項目37)

植物抽出物をさらに含む、項目1に記載の組成物。

(項目38)

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、

プロゲスターゲン；および

薬学的に受容可能なクリームキャリア、

を含み、ここで該プロゲスターゲンの処置量は、約2%～約30%の間の濃度で存在し、該組成物は、眼の眼瞼部分に適用される、組成物。

(項目39)

前記プロゲスターゲンは、約10%～約30%の濃度で存在する、項目38に記載の組成物。

(項目40)

前記プロゲスターゲンは、約15%～約25%の濃度で存在する、項目38に記載の組成物。

(項目41)

前記プロゲスターゲンは、約15%の濃度で存在する、項目38に記載の組成物。

(項目42)

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、

治療有効量のプロゲスターゲン；および

薬学的に受容可能なキャリア；

を含み、ここで該組成物は、眼の表面に適用される、組成物。

(項目43)

前記プロゲスターゲンはプロゲステロンである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 4 4)

前記プロゲスターゲンはプロゲステロンの誘導体である、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 4 5)

前記プロゲスターゲンは合成プロゲスターゲンである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 4 6)

前記プロゲスターゲンは酢酸メドロキシプロゲステロンである、項目 4 2 に記載の組成物

。

(項目 4 7)

前記プロゲスターゲンはノルエチンドロンである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 4 8)

前記プロゲスターゲンは酢酸ノルエチンドロンである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 4 9)

前記プロゲスターゲンは酢酸メゲストロールである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 5 0)

前記プロゲスターゲンは、17 - a - ヒドロキシプロゲステロンカプロエートである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 5 1)

前記プロゲスターゲンはノルゲストレルである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 5 2)

前記プロゲスターゲンは、約 0 . 0 1 % ~ 約 1 0 % の濃度で存在する、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 5 3)

前記プロゲスターゲンは、約 2 % の濃度で存在する、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 5 4)

前記プロゲスターゲンは、約 0 . 0 1 % ~ 約 1 0 % の濃度で存在する、項目 4 3 に記載の組成物。

(項目 5 5)

前記プロゲスターゲンは、約 2 % の濃度で存在する、項目 4 3 に記載の組成物。

(項目 5 6)

前記組成物は、1 日に 1 回適用される、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 5 7)

前記組成物は、1 日に少なくとも 2 回適用される、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 5 8)

前記組成物は、1 日に少なくとも約 4 回適用される、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 5 9)

前記組成物は、1 日に約 4 回 ~ 1 日に約 8 回の間で適用される、項目 4 2 に記載の組成物

。

(項目 6 0)

前記薬学的に受容可能なキャリアはクリームである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 1)

前記薬学的に受容可能なキャリアは軟膏である、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 2)

前記薬学的に受容可能なキャリアはゲルである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 3)

前記薬学的に受容可能なキャリアは液剤である、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 4)

前記薬学的に受容可能なキャリアはエマルジョンである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 5)

前記薬学的に受容可能なキャリアはローションである、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 6)

前記薬学的に受容可能なキャリアは実質的に密封性である、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 7)

前記組成物は、透過性促進剤をさらに含む、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 8)

前記組成物は、日焼け止め剤をさらに含む、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 6 9)

前記組成物は、保湿剤をさらに含む、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 7 0)

前記組成物は、ビタミンをさらに含む、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 7 1)

前記組成物は、植物抽出物をさらに含む、項目 4 2 に記載の組成物。

(項目 7 2)

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、

プロゲスターゲン；および

薬学的に受容可能なキャリア；

を含み、ここで該プロゲスターゲンの処置量は、約 0 . 0 1 % ~ 約 1 0 % の間の濃度で存在し、該組成物は、眼の表面に適用される、組成物。

(項目 7 3)

前記濃度は、約 2 % である、項目 7 2 に記載の組成物。

(項目 7 4)

ドライアイを処置するための方法であって、該方法は、

治療有効量のプロゲスターゲンおよび薬学的に受容可能なキャリアを含む組成物を、眼の膜部や部分に適用する工程、
を包含する、方法。

(項目 7 5)

前記プロゲスターゲンはプロゲステロンである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 7 6)

前記プロゲスターゲンはプロゲステロンの誘導体である、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 7 7)

前記プロゲスターゲンは合成プロゲスターゲンである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 7 8)

前記プロゲスターゲンは酢酸メドロキシプロゲステロンである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 7 9)

前記プロゲスターゲンはノルエチンドロンである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 0)

前記プロゲスターゲンは酢酸ノルエチンドロンである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 1)

前記プロゲスターゲンは酢酸メゲストロールである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 2)

前記プロゲスターゲンは、17 - a - ヒドロキシプロゲステロンカプロエートである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 3)

前記プロゲスターゲンはノルゲストレルである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 4)

前記組成物は、約 2 5 m g ~ 約 5 0 0 m g の間の量で適用される、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 5)

前記組成物は、約 1 0 0 m g ~ 約 4 0 0 m g の間の量で適用される、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 6)

前記組成物は、約 1 6 0 m g の量で適用される、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 7)

前記プロゲスターゲンは、約 2 % ~ 約 3 0 % の濃度で存在する、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 8)

前記プロゲスターゲンは、約 1 0 % ~ 約 3 0 % の濃度で存在する、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 8 9)

前記プロゲスターゲンは、約 1 5 % ~ 約 2 5 % の濃度で存在する、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 9 0)

前記プロゲスターゲンは、約 1 5 % の濃度で存在する、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 9 1)

前記プロゲステロンは、約 2 % ~ 約 3 0 % の濃度で存在する、項目 7 5 に記載の方法。

(項目 9 2)

前記プロゲステロンは、約 1 0 % ~ 約 3 0 % の濃度で存在する、項目 7 5 に記載の方法。

(項目 9 3)

前記プロゲステロンは、約 1 5 % ~ 約 2 5 % の濃度で存在する、項目 7 5 に記載の方法。

(項目 9 4)

前記プロゲステロンは、約 1 5 % の濃度で存在する、項目 7 5 に記載の方法。

(項目 9 5)

前記組成物は、1 日に 1 回適用される、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 9 6)

前記組成物は、1 日に少なくとも 2 回適用される、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 9 7)

前記組成物の約 5 0 m g ~ 約 1 0 0 m g が各々の眼に適用される、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 9 8)

前記組成物の約 8 0 m g が各々の眼に適用される、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 9 9)

前記薬学的に受容可能なキャリアはクリームである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 0)

前記薬学的に受容可能なキャリアは軟膏である、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 1)

前記薬学的に受容可能なキャリアはゲルである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 2)

前記薬学的に受容可能なキャリアは液剤である、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 3)

前記薬学的に受容可能なキャリアはエマルジョンである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 4)

前記薬学的に受容可能なキャリアはローションである、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 5)

前記薬学的に受容可能なキャリアは実質的に密封性である、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 6)

前記組成物は、透過性促進剤をさらに含む、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 7)

前記組成物は、日焼け止め剤をさらに含む、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 8)

前記組成物は、保湿剤をさらに含む、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 0 9)

前記組成物は、ビタミンをさらに含む、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 1 0)

前記組成物は、植物抽出物をさらに含む、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 1 1 1)

ドライアイを処置するための方法であって、該方法は、

プロゲスターゲンおよび薬学的に受容可能なクリームキャリアを含む組成物を適用する工程；

を包含し、ここで該プロゲスターゲンは、約 2 % ~ 約 3 0 % の間の濃度で存在し、該組成物は、眼の眼瞼部分に適用される、方法。

(項目 1 1 2)

前記プロゲスターゲンは、約 1 0 % ~ 約 3 0 % の濃度で存在する、項目 1 1 1 に記載の方法。

(項目 1 1 3)

前記プロゲスターゲンは、約 1 5 % ~ 約 2 5 % の濃度で存在する、項目 1 1 1 に記載の方法。

(項目 1 1 4)

前記プロゲスターゲンは、約 1 5 % の濃度で存在する、項目 1 1 1 に記載の方法。

(項目 1 1 5)

眼を処置するための方法であって、該方法は、

治療有効量のプロゲスターゲンおよび薬学的に受容可能なキャリアを含む組成物を、眼の表面に適用する工程、

を包含する、方法。

(項目 1 1 6)

前記プロゲスターゲンはプロゲステロンである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 1 7)

前記プロゲスターゲンは、プロゲステロンの誘導体である、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 1 8)

前記プロゲスターゲンは合成プロゲスターゲンである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 1 9)

前記プロゲスターゲンは、酢酸メドロキシプロゲステロンである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 2 0)

前記プロゲスターゲンはノルエチンドロンである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 2 1)

前記プロゲスターゲンは酢酸ノルエチンドロンである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 2 2)

前記プロゲスターゲンは酢酸メゲストロールである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 2 3)

前記プロゲスターゲンは 1 7 - a - ヒドロキシプロゲステロンカプロエートである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 2 4)

前記プロゲスターゲンはノルゲストレルである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 2 5)

前記プロゲスターゲンは、約 0 . 0 1 % ~ 約 1 0 % の濃度で存在する、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 2 6)

前記プロゲスターゲンは、約 2 % の濃度で存在する、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 2 7)

前記プロゲステロンは、約 0 . 0 1 % ~ 約 1 0 % の濃度で存在する、項目 1 1 6 に記載の方法。

(項目 1 2 8)

前記プロゲステロンは、約 2 % の濃度で存在する、項目 1 1 6 に記載の方法。

(項目 1 2 9)

前記組成物は、1 日に 1 回適用される、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 0)

前記組成物は、1 日に少なくとも 2 回適用される、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 1)

前記組成物は、1 日に少なくとも約 4 回適用される、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 2)

前記組成物は、1 日に約 4 回から 1 日に約 8 回の間で適用される、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 3)

前記薬学的に受容可能なキャリアはクリームである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 4)

前記薬学的に受容可能なキャリアは軟膏である、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 5)

前記薬学的に受容可能なキャリアはゲルである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 6)

前記薬学的に受容可能なキャリアは液剤である、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 7)

前記薬学的に受容可能なキャリアはエマルジョンである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 8)

前記薬学的に受容可能なキャリアはローションである、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 3 9)

前記薬学的に受容可能なキャリアは実質的に密封性である、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 4 0)

前記組成物は、透過性促進剤をさらに含む、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 4 1)

前記組成物は、日焼け止め剤をさらに含む、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 4 2)

前記組成物は、保湿剤をさらに含む、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 4 3)

前記組成物は、ビタミンをさらに含む、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 4 4)

前記組成物は、植物抽出物をさらに含む、項目 1 1 5 に記載の方法。

(項目 1 4 5)

眼の状態を処置するための方法であって、該方法は、

プロゲスターゲンおよび薬学的に受容可能なクリームキャリアを含む組成物を適用する工程

を包含し、ここで該プロゲスターゲンは、約 0 . 1 % ~ 約 1 0 % の間の濃度で存在し、該組成物は、眼の表面に適用される、方法。

(項目 1 4 6)

前記プロゲスターゲンは、約 2 % の濃度で存在する、項目 1 4 5 に記載の方法。

【手続補正 2】

【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】**

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、
治療有効量のプロゲスターゲン；および
薬学的に受容可能なキャリア；
を含み、ここで該組成物は、眼の眼瞼部分に適用される、組成物。

【請求項 2】

前記プロゲスターゲンはプロゲステロンである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記組成物は、約 25 mg ~ 約 500 mg の間の量で適用される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記プロゲスターゲンは、約 2 % ~ 約 30 % の濃度で存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記組成物は 1 日に 1 回または 2 回適用される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記組成物の約 50 mg ~ 約 100 mg が、各々の眼に適用される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、
プロゲスターゲン；および
薬学的に受容可能なクリームキャリア、
を含み、ここで該プロゲスターゲンの処置量は、約 15 % の濃度で存在し、該組成物は、
眼の眼瞼部分に適用される、組成物。

【請求項 8】

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、
プロゲスターゲン；および
薬学的に受容可能なクリームキャリア、
を含み、ここで該プロゲスターゲンの処置量は、約 2 % ~ 約 30 % の間の濃度で存在し、
該組成物は、眼の眼瞼部分に適用される、組成物。

【請求項 9】

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、
治療有効量のプロゲスターゲン；および
薬学的に受容可能なキャリア；
を含み、ここで該組成物は、眼の表面に適用される、組成物。

【請求項 10】

ドライアイを処置するための組成物であって、該組成物は、
プロゲスターゲン；および
薬学的に受容可能なキャリア；
を含み、ここで該プロゲスターゲンの処置量は、約 0.01 % ~ 約 10 % の間の濃度で存在し、
該組成物は、眼の表面に適用される、組成物。