

【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21年4月16日 (2009.4.16)

【公表番号】特表2008-540533(P2008-540533A)

【公表日】平成20年11月20日 (2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-511215(P2008-511215)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/165

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/18

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 27/06

【手続補正書】

【提出日】平成21年2月26日 (2009.2.26)

【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】

局所投与可能な水性眼用懸濁組成物であって、該組成物は、

(a) 0 . 0 0 1 ~ 0 . 0 5 % (w / v) の、25 で水溶性を有する眼用薬物；

(b) 0 . 5 ~ 1 . 5 % (w / v) の量の、ポロキサミン非イオン性界面活性剤；

(c) 少なくとも 1 . 0 % (w / v) であるが 4 . 0 % (w / v) 未満の量の、プロピレングリコール；グリセロール；ジプロピレングリコール；ジエチレングリコール；トリエチレングリコール；1, 3 - ブチレングリコール；2, 3 - ブチレングリコール；3 - メチル - 1, 3 - ブチレングリコール；ジグリセロール；エリトリトール；ペンタエリトリトール；およびネオペンチルグリコールからなる群より選択されるグリコール張度調整剤；ならびに

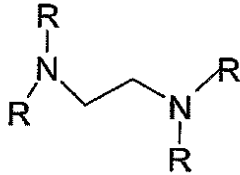
(d) 水；

を含有し、

該組成物は、150 ~ 500 m O s m / K g の浸透圧重量モル濃度を有し、

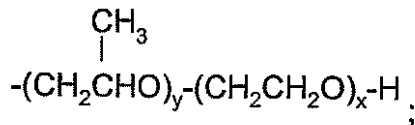
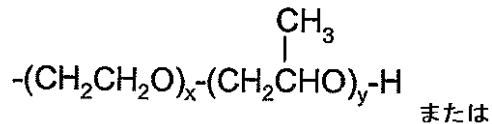
該ポロキサミン非イオン性界面活性剤は、式：

【化 1】



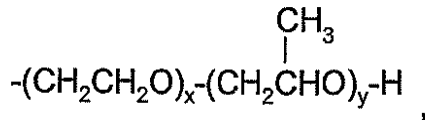
を有し、該式中、R =

【化 2】



であり、但し、R が

【化 3】

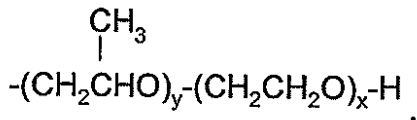


である場合、

x は 2 ~ 130 であり、そして y は 2 ~ 125 であり、但し、x は x + y の 10 ~ 80 % であり、そして但し、該ポロキサミン非イオン性界面活性剤の数平均分子量は 1,600 ~ 30,000 であり、

そして R が

【化 4】



である場合、

x は 2 ~ 90 であり、そして y は 2 ~ 90 であり、但し、x は x + y の 10 ~ 80 % であり、そして但し、該ポロキサミン非イオン性界面活性剤の数平均分子量は 2,600 ~ 21,000 である、

組成物。

【請求項 2】

前記眼用薬物は、非ステロイド性抗炎症化合物；カルボニックアンヒドラーゼインヒビター；抗真菌剤；ホスホジエステラーゼⅣインヒビター；レセプターチロシンキナーゼインヒビター；およびステロイドからなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記眼用薬物は、ネパフェナク；プリンゾラミド；ナタマイシン；ロフルミラスト；フルオロメトロン；ヒドロコルチゾン；デキサメタゾン；プレドニゾン；ロテプレドノール；およびメドリゾンからなる群より選択される、請求項 2 に記載の組成物。

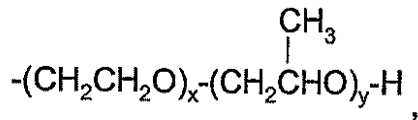
【請求項 4】

前記眼用薬物は、ネパフェナクである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

R は

【化 5】



であり、

x は約 20 であり、そして y は約 30 であり、そして該ポロキサミン界面活性剤の数平均分子量は約 10,500 である、

請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記ポロキサミン非イオン性界面活性剤は、0.75 ~ 1.25 % (w/v) の量で存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記ポロキサミン非イオン性界面活性剤は、1.0 % (w/v) の量で存在する、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記グリコール張度調整剤は、プロピレングリコール；グリセロール；およびこれらの混合物からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記グリコール張度調整剤は、2.0 ~ 3.5 % (w/v) の量で存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記グリコール張度調整剤は、プロピレングリコール；グリセロール；およびこれらの混合物からなる群より選択される、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記グリコール張度調整剤は、3.0 % (w/v) の量で存在する、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記組成物は、塩化金属塩および非イオン性張度調整剤からなる群より選択される張度調整剤をさらに含有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記組成物は、緩衝剤；pH 調整剤；キレート剤；および保存剤からなる群より選択される賦形剤をさらに含有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記組成物は、高分子懸濁化剤を含まない、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 15】

局所投与可能な水性眼用懸濁組成物であって、該組成物は、

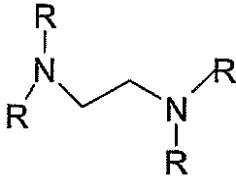
- (a) 0.01 ~ 0.3 % (w/v) の、ネパフェナク；
- (b) 0.5 ~ 1.5 % (w/v) の、ポロキサミン非イオン性界面活性剤；
- (c) 2.0 ~ 3.5 % (w/v) の、プロピレングリコール；グリセロール；およびこれらの混合物からなる群より選択されるグリコール張度調整剤；
- (d) 0.001 ~ 0.1 % (w/v) の、エデト酸二ナトリウム；
- (e) 0.001 ~ 0.01 % (w/v) の、眼科的に受容可能な保存剤；ならびに
- (f) 水；

を含有し、

該組成物は、7.5 ~ 8.0 の pH および 250 ~ 500 mOsm/Kg の浸透圧重量モ

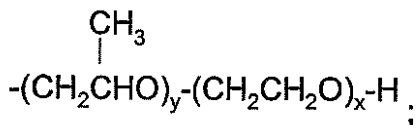
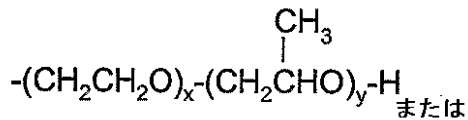
ル濃度を有し、
該ポロキサミン非イオン性界面活性剤は、式：

【化 6】



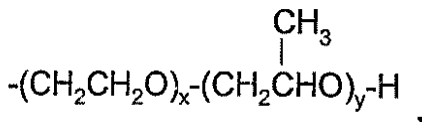
を有し、該式中、R =

【化 7】



であり、但し、R が

【化 8】

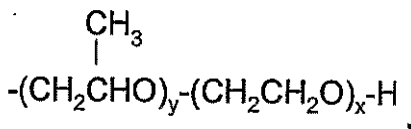


である場合、

x は 2 ~ 130 であり、そして y は 2 ~ 125 であり、但し、x は x + y の 10 ~ 80 % であり、そして但し、該ポロキサミン非イオン性界面活性剤の数平均分子量は 1,600 ~ 30,000 であり；

そして R が

【化 9】



である場合、

x は 2 ~ 90 であり、そして y は 2 ~ 90 であり、但し、x は x + y の 10 ~ 80 % であり、そして但し、該ポロキサミン非イオン性界面活性剤の数平均分子量は 2,600 ~ 21,000 である、

組成物。

【請求項 16】

亜硫酸ナトリウム；亜硫酸カリウム；亜硫酸マグネシウム；亜硫酸カルシウム；亜重硫酸ナトリウム；亜重硫酸カリウム；亜重硫酸マグネシウム；亜重硫酸カルシウム；メタ亜重硫酸ナトリウム；メタ亜重硫酸カリウム；およびメタ亜重硫酸カルシウムからなる群より選択される亜硫酸塩をさらに含有する、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

眼の障害を処置するための、局所投与可能な水性懸濁組成物であって、該組成物は、

(a) 薬学的に有効な量のネパフェナク；

(b) 0.5 ~ 1.5 % (w/v) の量のポロキサミン非イオン性界面活性剤；

(c) 少なくとも 1.0% (w/v) であるが 4.0% (w/v) 未満である量のグリコール張度調整剤；および

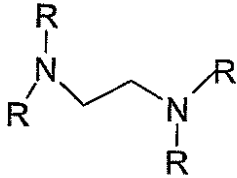
(d) 水；

を含有し、

該組成物は、150～500 mOsm/Kg の浸透圧重量モル濃度を有し、

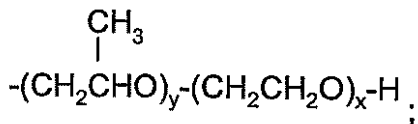
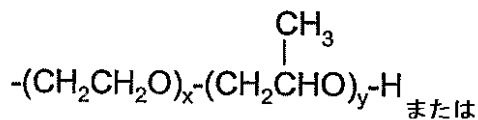
該ポロキサミン非イオン性界面活性剤は、式：

【化 10】



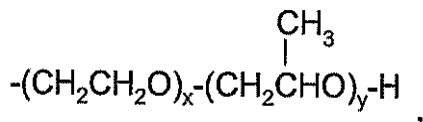
を有し、該式中、R =

【化 11】



であり、但し、R が

【化 12】

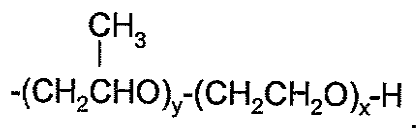


である場合、

x は 2～130 であり、そして y は 2～125 であり、但し、x は x + y の 10～80% であり、そして但し、該ポロキサミン非イオン性界面活性剤の 数平均分子量 は 1,600～30,000 であり、

そして R が

【化 13】



である場合、

x は 2～90 であり、そして y は 2～90 であり、但し、x は x + y の 10～80% であり、そして但し、該ポロキサミン非イオン性界面活性剤の 数平均分子量 は 2,600～21,000 であり、

該グリコール張度調整剤は、プロピレングリコール；グリセロール；ジプロピレングリコール；ジエチレングリコール；トリエチレングリコール；1,3-ブチレングリコール；2,3-ブチレングリコール；3-メチル-1,3-ブチレングリコール；ジグリセロール；エリトリトール；ペンタエリトリトール；およびネオペンチルグリコールからなる群より選択され；

そして但し、該眼の障害は、眼表面の疼痛；ブドウ膜炎；強膜炎；上強膜炎；角膜炎；外

科手術によって誘導された炎症；眼内炎；虹彩炎；萎縮性黄斑変性；色素性網膜炎；医源性網膜症；網膜裂孔および網膜孔；嚢胞様黄斑水腫；糖尿病黄斑水腫；糖尿病網膜症；鎌状赤血球網膜症；網膜静脈および網膜動脈閉塞；視神経症；滲出性黄斑変性；血管新生緑内障；角膜血管新生；毛様体炎；鎌状赤血球網膜症；および翼状片からなる群より選択される、

組成物。

【請求項 18】

前記組成物は、

- (a) 0.01 ~ 0.3 % (w/v) の、ネパフェナク；
- (b) 0.5 ~ 1.5 % (w/v) の、前記ボロキサミン非イオン性界面活性剤；
- (c) 2.0 ~ 3.5 % (w/v) の、プロピレングリコール；グリセロール；およびこれらの混合物からなる群より選択されるグリコール張度調整剤；
- (d) 0.001 ~ 0.1 % (w/v) の、エデト酸二ナトリウム；
- (e) 0.001 ~ 0.01 % (w/v) の眼科的に受容可能な保存剤；および
- (f) 水；

を含有し、

該組成物は、7.5 ~ 8.0 の pH を有する、

請求項 17 に記載の 組成物。