

【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】令和4年3月4日(2022.3.4)

【公開番号】特開2021-102626(P2021-102626A)
 【公開日】令和3年7月15日(2021.7.15)
 【年通号数】公開・登録公報2021-031
 【出願番号】特願2021-40110(P2021-40110)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/498(2006.01)
 A 6 1 K 31/5377(2006.01)
 A 6 1 P 27/02(2006.01)
 A 6 1 P 27/06(2006.01)
 A 6 1 K 9/08(2006.01)
 A 6 1 K 47/04(2006.01)
 A 6 1 K 47/38(2006.01)
 A 6 1 K 47/18(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 31/498
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 27/06
 A 6 1 K 9/08
 A 6 1 K 47/04
 A 6 1 K 47/38
 A 6 1 K 47/18

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年2月24日(2022.2.24)

【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】

緑内障及び高眼圧を治療するためまたは眼圧を降下するための、活性薬剤を含む水性組成物であって、前記活性薬剤が、0.1% w/vのプリモニジン酒石酸塩及び0.68% w/vのチモロールマレイン酸塩からなり、前記組成物がさらに、カルボキシメチルセルロースナトリウム、及び、緩衝剤としてホウ酸ナトリウム十水和物を含み、及び、前記組成物のpHが7である、水性組成物。

40

【請求項2】

0.1% w/vのプリモニジン酒石酸塩、0.68% w/vのチモロールマレイン酸塩、0.1% w/vの塩化ナトリウム、2.15% w/vのリン酸ナトリウム二塩基性七水和物、0.22% w/vのリン酸ナトリウム一塩基性一水和物、及び水からなる、緑内障及び高眼圧の治療をするためまたは眼圧を降下するための水性組成物。

【請求項3】

0.1% w/vのプリモニジン酒石酸塩、0.68% w/vのチモロールマレイン酸塩、0.6% w/vのホウ酸、0.38%のホウ酸ナトリウム十水和物、0.5% w/vのカルボキシメチルセルロースナトリウム、0.32% w/vの塩化ナトリウム、及び水から

50

なる、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

pH が 7.0 である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5】

さらに、pH を調整するために水酸化ナトリウム及び塩酸の一方または両方を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記組成物の 1 日 2 回の投与が、少なくとも、0.2% w/v のプリモニジン酒石酸塩及び 0.5% w/v のチモロールマレイン酸塩の固定用量を含む第二の組成物の 1 日 2 回の投与と同様に有効である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の組成物。

10

【請求項 7】

前記組成物の 1 日 2 回の投与が、0.2% w/v のプリモニジン酒石酸塩及び 0.68% w/v のチモロールマレイン酸塩の固定用量を含む第二の組成物の 1 日 2 回の投与と比べた場合に、1 種または複数の有害事象の発生率の低下をもたらす、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 8】

前記 1 種または複数の有害事象が、アレルギー性結膜炎、結膜濾胞症、結膜充血、目のそう痒、眼灼熱感、及び眼刺痛からなる群より選択される、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

保存剤を含まない、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

20

【請求項 10】

さらに、塩化ベンザルコニウムを含む、請求項 1 及び 5 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 11】

前記塩化ベンザルコニウムが、0.001% w/v ~ 0.05% w/v の濃度で存在する、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

局所的点眼用に構成されている、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0052

30

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0052】

当然ながら、本明細書中開示される実施形態は、請求項の原理を例示するものである。採用可能な他の修飾物は、請求項の範囲内にある。すなわち、限定ではなく例として、代替実施形態を、本明細書の教示に従って利用することができる。したがって、請求項は、示され及び記載されるとおりそのままの実施形態に限定されるのではない。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕約 0.1% w/v のプリモニジン酒石酸塩及び約 0.68% w/v のチモロールマレイン酸塩を含む、組成物。

40

〔2〕前記組成物は、0.1% w/v のプリモニジン酒石酸塩及び 0.68% w/v のチモロールマレイン酸塩を含むものである、前記〔1〕に記載の組成物。

〔3〕前記組成物は、0.1% w/v のプリモニジン酒石酸塩、0.68% w/v のチモロールマレイン酸塩、0.1% w/v の塩化ナトリウム、2.15% w/v のリン酸ナトリウム二塩基性七水和物、0.22% w/v のリン酸ナトリウム一塩基性一水和物、及び水を含むものである、前記〔2〕に記載の組成物。

〔4〕前記組成物は、0.1% w/v のプリモニジン酒石酸塩、0.68% w/v のチモロールマレイン酸塩、0.6% w/v のホウ酸、0.38% のホウ酸ナトリウム十水和物、0.5% w/v のカルボキシメチルセルロース、0.32% w/v の塩化ナトリウム、及び水を含むものである、前記〔2〕に記載の組成物。

50

〔 5 〕前記組成物は、さらに、リン酸ナトリウム二塩基性七水和物及びホウ酸ナトリウム十水和物からなる群より選択される少なくとも1種類の緩衝剤を含む、前記〔 1 〕に記載の組成物。

〔 6 〕前記組成物は、pHが約7である、先行態様のいずれか1項に記載の組成物。

〔 7 〕前記組成物は、pHが7.0である、前記〔 6 〕に記載の組成物。

〔 8 〕前記組成物は、さらに、水酸化ナトリウム及び塩酸の一方または両方を含む、前記〔 1 〕～〔 7 〕のいずれか1項に記載の組成物。

〔 9 〕前記組成物の1日2回の投与は、少なくとも、0.2% w/vのプリモニジン酒石酸塩及び0.5% w/vのチモロールマレイン酸塩の固定用量を含む第二の組成物の1日2回の投与と同様に有効である、前記〔 1 〕～〔 8 〕のいずれか1項に記載の組成物。

〔 10 〕前記組成物の1日2回の投与は、0.2% w/vのプリモニジン酒石酸塩及び0.68% w/vのチモロールマレイン酸塩の固定用量を含む第二の組成物の1日2回の投与と比べた場合に、1種または複数の有害事象の発生率の低下をもたらす、前記〔 1 〕～〔 9 〕のいずれか1項に記載の組成物。

〔 11 〕前記1種または複数の有害事象は、アレルギー性結膜炎、結膜濾胞症、結膜充血、目のそう痒、眼灼熱感、及び眼刺痛からなる群より選択される、前記〔 10 〕に記載の組成物。

〔 12 〕前記組成物は、保存剤を含まないものである、前記〔 1 〕～〔 11 〕のいずれか1項に記載の組成物。

〔 13 〕前記組成物は、さらに、塩化ベンザルコニウムを含むものである、前記〔 1 〕～〔 11 〕のいずれか1項に記載の組成物。

〔 14 〕前記塩化ベンザルコニウムは、約0.001% w/v～約0.05% w/vの濃度で存在する、前記〔 13 〕に記載の組成物。

〔 15 〕前記組成物は、局所的点眼用に構成されている、前記〔 1 〕～〔 14 〕のいずれか1項に記載の組成物。

〔 16 〕前記組成物は、緑内障及び高眼圧の治療用のものである、前記〔 1 〕～〔 15 〕のいずれか1項に記載の組成物。

〔 17 〕眼圧を降下するための組成物であって、該組成物は、本質的に、0.1% w/vのプリモニジン酒石酸塩、0.68% w/vのチモロールマレイン酸塩、0.1% w/vの塩化ナトリウム、2.15% w/vのリン酸ナトリウム二塩基性七水和物、0.22% w/vのリン酸ナトリウム一塩基性一水和物、及び水からなるものである、前記組成物。

〔 18 〕眼圧を降下するための組成物であって、該組成物は、本質的に、0.1% w/vのプリモニジン酒石酸塩、0.68% w/vのチモロールマレイン酸塩、0.6% w/vのホウ酸、0.38%のホウ酸ナトリウム十水和物、0.5% w/vのカルボキシメチルセルロース、0.32% w/vの塩化ナトリウム、及び水からなるものである、前記組成物。

〔 19 〕包装材料及び該包装材料に入れられた医薬作用剤を含む製品であって、該包装材料は、該医薬作用剤が眼圧降下用に使用可能であることを示すラベルを含み、かつ該医薬作用剤は、眼圧降下に治療上有効であり、該医薬作用剤は、0.1%のプリモニジン酒石酸塩及び0.68%のチモロールマレイン酸塩を含む、前記製品。

〔 20 〕前記医薬作用剤は、0.1% w/vのプリモニジン酒石酸塩、0.68% w/vのチモロールマレイン酸塩、0.1% w/vの塩化ナトリウム、2.15% w/vのリン酸ナトリウム二塩基性七水和物、0.22% w/vのリン酸ナトリウム一塩基性一水和物、及び水を含む、前記〔 19 〕に記載の製品。

〔 21 〕前記医薬作用剤は、0.1% w/vのプリモニジン酒石酸塩、0.68% w/vのチモロールマレイン酸塩、0.6% w/vのホウ酸、0.38%のホウ酸ナトリウム十水和物、0.5% w/vのカルボキシメチルセルロース、0.32% w/vの塩化ナトリウム、及び水を含む、前記〔 19 〕に記載の製品。

〔 22 〕前記医薬作用剤は、単位用量の保存剤を含まない構成で提供される、前記〔 19 〕～〔 21 〕のいずれか1項に記載の製品。

10

20

30

40

50

〔 2 3 〕 前記医薬作用剤は、複数用量の保存剤を含まない構成で提供される、前記〔 1 9 〕～〔 2 1 〕のいずれか 1 項に記載の製品。

〔 2 4 〕 前記医薬作用剤は、1 種または複数の保存剤で保存されている複数用量の構成で提供される、前記〔 1 9 〕から〔 2 1 〕のいずれか 1 項に記載の製品。

〔 2 5 〕 緑内障または高眼圧の治療方法であって、約 0 . 1 % w / v のプリモニジン酒石酸塩及び約 0 . 6 8 % w / v のチモロールマレイン酸塩を含む単独組成物を有効量で投与することを含む、前記方法。

〔 2 6 〕 前記組成物は、1 日 2 回、目に投与される、前記〔 2 5 〕に記載の方法。

〔 2 7 〕 前記組成物の 1 日 2 回の投与は、0 . 2 % w / v のプリモニジン酒石酸塩及び 0 . 5 % w / v のチモロールマレイン酸塩を含む第二の単独組成物の 1 日 2 回の投与と比べた場合に、1 種または複数の有害事象の発生率の低下をもたらす、前記〔 2 6 〕に記載の方法。

〔 2 8 〕 前記 1 種または複数の有害事象は、アレルギー性結膜炎、結膜濾胞症、結膜充血、目のそう痒、眼灼熱感、及び眼刺痛からなる群より選択される、前記〔 2 7 〕に記載の方法。

10

20

30

40

50