

【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19年9月13日(2007.9.13)

【公開番号】特開2007-182438(P2007-182438A)

【公開日】平成19年7月19日(2007.7.19)

【年通号数】公開・登録公報2007-027

【出願番号】特願2006-330084(P2006-330084)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/12

【手続補正書】

【提出日】平成19年7月30日(2007.7.30)

【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】

(S)－(－)－1－(4－フルオロ－5－イソキノリンスルフォニル)－2－メチル－1, 4－ホモピペラジン若しくはその塩又はそれらの溶媒和物、リン酸又はその塩及びグリセリンを含有する点眼用組成物。

【請求項2】

pHが5～9である請求項1記載の組成物。

【請求項3】

(S)－(－)－1－(4－フルオロ－5－イソキノリンスルフォニル)－2－メチル－1, 4－ホモピペラジン若しくはその塩又はそれらの溶媒和物及びリン酸又はその塩を含有する点眼用組成物に、グリセリンを配合することを特徴とする、(S)－(－)－1－(4－フルオロ－5－イソキノリンスルフォニル)－2－メチル－1, 4－ホモピペラジン若しくはその塩又はそれらの溶媒和物の結晶析出抑制方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0005

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0005】

経時的な結晶析出を抑制する手段としては、一般的に、組成物処方中に糖アルコール、糖類、多価アルコールを配合する方法（特許文献2）が知られている。しかしながら、析出結晶の性質や状態は、有効成分の種類によってそれぞれ異なるものであり、斯かる方法が汎用されるものではない。

【特許文献1】特開平11-349482号公報

【特許文献2】特開平8-231403号公報

【非特許文献1】I O V S, 42 (1), 137-144 (2001)

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

本発明の点眼用組成物は、(S)-(1)-(4-フルオロ-5-イソキノリンスルフォニル)-2-メチル-1,4-ホモピペラジン若しくはその塩又はそれらの溶媒和物、リン酸又はその塩、及びグリセリンを含有するものである。

(S)-(1)-(4-フルオロ-5-イソキノリンスルフォニル)-2-メチル-1,4-ホモピペラジンは、Rhキナーゼ阻害作用の他にサブスタンスP拮抗作用及びロイコトリエンD4拮抗作用を有する公知の化合物であり（前記特許文献1）、公知の方法、例えば、国際特許公開第99/20620号パンフレットに記載の方法により製造することができる。