

【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3年11月4日(2021.11.4)

【公表番号】特表2020-533321(P2020-533321A)

【公表日】令和2年11月19日(2020.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2020-047

【出願番号】特願2020-513886(P2020-513886)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/245 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/46 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/245

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/46

A 6 1 K 47/36

【手続補正書】

【提出日】令和3年9月13日(2021.9.13)

【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】

a) 局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための、治療に有効な量のクロロプロカイン、またはその医薬として許容可能な塩と；

b) 1種類以上の増粘剤と；

c) 水

を含む、局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための表面麻酔製剤。

【請求項2】

a) 局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための、治療に有効な量のクロロプロカイン、またはその医薬として許容可能な塩と；

b) 1種類以上の増粘剤と；

c) 水

を含む、局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための表面麻酔ゲル製剤。

【請求項3】

a) 局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための、治療に有効な量のクロロプロカイン、またはその医薬として許容可能な塩と；

b) 1種類以上の増粘剤と；

c) 水

を含む、局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための眼科用ゲル製剤。

【請求項 4】

顕著な刺激または毒性を誘導せずに局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための、請求項 1～3のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 5】

眼科手術の間に、または角膜の擦過傷または損傷に対処するのに角膜表面に局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための、請求項 1～4のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 6】

2重量%～4重量%のクロロプロカイン、またはその医薬として許容可能な塩を含む、請求項 1～5のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 7】

2重量%～4重量%のクロロプロカインHCl、またはその医薬として許容可能な塩を含む、請求項 1～6のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 8】

約3重量%のクロロプロカインHClを含む、請求項 1～7のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 9】

前記増粘剤の選択が、セルロース誘導體、天然ゴム、無機化合物からなるグループからなされる、請求項 1～8のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 10】

前記増粘剤の選択が、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、キサンタンゴム、グアルゴム、ペクチン、ケイ酸アルミニウム、ケイ酸マグネシウムアルミニウム、シリカと、これらの組み合わせからなるグループからなされる、請求項 1～9のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 11】

0.5重量%～1.5重量%のヒドロキシセルロースを含む、請求項 1～10のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 12】

0.6重量%～1.4重量%のヒドロキシセルロースを含む、請求項 1～11のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 13】

酸性pH調節剤をさらに含む、請求項 1～12のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 14】

pHを2.8～3.8にするのに十分な量の酸性pH調節剤をさらに含む、請求項 1～13のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 15】

pHを3.0～4.0にするのに十分な量の酸性pH調節剤をさらに含む、請求項 1～14のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 16】

塩酸、乳酸、クエン酸、酒石酸をさらに含む、請求項 1～15のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 17】

pHを2.8～4.0にするのに十分な量の塩酸をさらに含む、請求項 1～16のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 18】

粘性を300～1500 mPaにするのに十分な量のヒドロキシエチルセルロースを含む、請求項 1～17のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 19】

- a) 3重量%のクロロプロカインHClと；
- b) 0.6%～1.4%のヒドロキシエチルセルロースと；
- c) pHを2.8～4.0にするのに十分な量の塩酸と；
- d) 100%にするのに十分な量の精製水

を含む、請求項1～18のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 20】

- a) 3重量%のクロロプロカインHClと；
- b) 600～1400 mPaにするのに十分な量のヒドロキシエチルセルロースと；
- c) pHを2.8～4.0にするのに十分な量の塩酸と；
- d) 100%にするのに十分な量の精製水

を含む、請求項1～19のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 21】

無菌である、請求項1～20のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 22】

前記水が、窒素パブリングによって脱ガスされた水である、請求項1～21のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 23】

欧州薬局方2016年版の2.2.10節に記載されているようにBrookField DV II+Pro Spindle 3を100 rpmにして測定したとき300～1500 mPaの粘性を持つ、請求項1～22のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 24】

ゲル、ローション、軟膏、ペースト、クリーム of いずれかの形態である、請求項1～23のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 25】

0.5～2 gのゲルを含む単回投与パッケージの形態である、請求項1～24のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 26】

透明または半透明である、請求項1～25のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 27】

空気圧または窒素圧のもとで40～70にて幅が0.22～0.45ミクロンの孔を有する親水性カートリッジを通過することができる、請求項1～26のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 28】

請求項1～27のいずれか1項に記載の製剤を製造する方法であって、前記クロロプロカイン、またはその医薬として許容可能な塩と、前記1種類以上の増粘剤と、pH調節剤と、前記水を混合して製剤にすることを含む方法。

## 【請求項 29】

- a) 前記1種類以上の増粘剤と、前記pH調節剤と、水を混合してプラセボマトリックスを作り、
- b) そのプラセボマトリックスを熱で殺菌し、
- c) クロロプロカインまたはその医薬として許容可能な塩を水と混合し、場合によってはpH調節剤とも混合して薬溶液を調製し、
- d) その薬溶液を、幅が0.22～0.45ミクロンの孔を有するフィルタを通過させることによって殺菌し、
- e) 前記プラセボマトリックスと前記薬溶液を混合して前記製剤にすることを含む、請求項28に記載の方法。

## 【請求項 30】

3重量%のクロロプロカインHClと、0.25～2.0%のヒドロキシエチルセルロースと、pHを2.8～4.0にするのに十分な量の塩酸と、100%にするのに十分な精製水を混合して前記製剤にすることを含む、請求項28または29に記載の方法。

## 【請求項 3 1】

前記製剤を空気の存在下で容器に充填することをさらに含む、請求項28、29、30のいずれか1項に記載の方法。

## 【請求項 3 2】

前記容器が、0.5～2 gのゲル製剤を含む単回投与容器である、請求項31に記載の方法。

## 【請求項 3 3】

局所的な鎮痛または麻酔を必要とする対象哺乳動物で局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための製剤であって、該哺乳動物の体表に投与される、請求項1～27のいずれか1項に記載の製剤。

## 【請求項 3 4】

顕著な刺激または毒性を誘導せずに局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための、請求項33に記載の製剤。

## 【請求項 3 5】

眼科手術の間に、または角膜の擦過傷または損傷に対処するのに角膜表面に局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための、請求項33または34に記載の製剤。

## 【請求項 3 6】

白内障手術、黄斑変性症の処置、従来緑内障手術、硝子体切除、糖尿病性腎症のための手術、レーザー手術のいずれかを実施している間、角膜表面に局所的な鎮痛または麻酔を誘導するための、請求項33～35のいずれか1項に記載の製剤。