

【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 9 月 13 日(2022.9.13)

【公開番号】特開 2022-120125(P2022-120125A)

【公開日】令和 4 年 8 月 17 日(2022.8.17)

【年通号数】公開公報(特許)2022-150

【出願番号】特願 2022-95460(P2022-95460)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/506(2006.01)

10

A 6 1 K 9/06(2006.01)

A 6 1 K 9/08(2006.01)

A 6 1 K 9/10(2006.01)

A 6 1 K 9/12(2006.01)

A 6 1 K 9/14(2006.01)

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 K 38/13(2006.01)

A 6 1 K 31/706(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

20

【F I】

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 9/14

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 38/13

A 6 1 K 31/706

A 6 1 P 43/00 1 2 1

30

【手続補正書】

【提出日】令和 4 年 9 月 5 日(2022.9.5)

【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】

40

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

治療有効量の (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、  
またはその薬学的に許容される塩を含み、それを必要とする個体に経鼻投与される、ドライアイの治療のための医薬製剤。

【請求項 2】

治療有効量の (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、  
またはその薬学的に許容される塩を含み、それを必要とする個体に経鼻投与される、眼の不快感の治療のための医薬製剤であって、

該眼の不快感が、そう痒、乾燥、羞明、ぼやけ、疼痛、べたつき感、灼熱感、刺痛およ

50

び異物感からなる群より選択される症状である、医薬製剤。

【請求項 3】

治療有効量の (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含み、それを必要とする個体に経鼻投与される、涙液産生の増加のための医薬製剤。

【請求項 4】

治療有効量の (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含み、それを必要とする個体に経鼻投与される、それを必要とする個体により産生される 1 つ以上の涙液タンパク質の量または濃度の増加のための医薬製剤。

10

【請求項 5】

前記 1 つ以上の涙液タンパク質が、上皮成長因子、ラクトフェリン、ラクリチン、プロラクチン、副腎皮質刺激ホルモン、ロイシンエンケファリン、ALS2CL、ARHGEF19、KIAA1109、PLXNA1、POLG、WIP1、またはZMIZ2から選択される、請求項 4 に記載の医薬製剤。

【請求項 6】

前記薬学的に許容される塩が、(R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジンのガラクトール酸塩またはクエン酸塩である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 7】

前記薬学的に許容される塩が、(R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジンモノクエン酸塩である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

20

【請求項 8】

前記薬学的に許容される塩が、(R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジンヘミガラクトール酸塩である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 9】

前記薬学的に許容される塩が、(R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジンヘミガラクトール酸塩二水和物または (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジンヘミガラクトール酸塩一水和物である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

30

【請求項 10】

1  $\mu$ g ~ 5 mg の (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含み、それを必要とする個体に経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 11】

1  $\mu$ g ~ 3 mg の (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含み、それを必要とする個体に経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 12】

1  $\mu$ g ~ 3 mg の (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含み、それを必要とする個体に、1 日 2 回経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

40

【請求項 13】

500  $\mu$ g ~ 5 mg の (R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含み、それを必要とする個体に経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 14】

(R) - 5 - ( (E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、少なくとも 1 日 1 回経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一

50

項に記載の医薬製剤。

【請求項 15】

(R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、少なくとも 1 日 2 回経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 16】

(R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、液体、懸濁液、エアロゾル、ゲル、軟膏、乾燥粉末、クリーム、ペースト、ローション、またはバームとして経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

10

【請求項 17】

(R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、注射器、滴瓶、ボトルネブライザー、噴霧ポンプ、粉末スプレー装置、気化器、薬用スティック、ピペット、液体ジェット、またはスプレー式点鼻薬ボトルによって経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 18】

前記 (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、10 mg / mL ~ 25 mg / mL の (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含有する医薬製剤において経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

20

【請求項 19】

前記 (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、5 mg / mL ~ 50 mg / mL の (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含有する医薬製剤において経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 20】

(R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、約 1 mg / mL の (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含有する医薬製剤において経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

30

【請求項 21】

前記 (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、約 2 mg / mL の (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含有する医薬製剤において経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 22】

前記 (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、約 5 mg / mL の (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含有する医薬製剤において経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

40

【請求項 23】

(R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、約 6 mg / mL の (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含有する医薬製剤において経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 24】

前記 (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、約 10 mg / mL の (R) - 5 - ((E) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含有する医薬製剤において経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

50

## 【請求項 25】

前記 (R) - 5 - ( ( E ) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、約 20 mg / mL の (R) - 5 - ( ( E ) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩を含有する医薬製剤において経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

## 【請求項 26】

防腐剤を含まない、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

## 【請求項 27】

(R) - 5 - ( ( E ) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、医療器具を用いて経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

10

## 【請求項 28】

前記 (R) - 5 - ( ( E ) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、眼科外科手術の前または後に経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

## 【請求項 29】

ドライアイまたは眼の不快感が、眼科外科手術または眼科的治療の結果である、請求項 1 または 2 に記載の医薬製剤。

## 【請求項 30】

前記眼科外科手術が、白内障手術、屈折レンズ交換、緑内障手術、レーザー眼科手術、硝子体切除術、網膜光凝固、網膜剥離修復、黄斑円孔修復、後部虹彩腫瘍もしくは腫瘍の除去、後強膜切開術、または視神経切離であるか、または、

20

前記眼科的治療が、放射線療法を含む、請求項 29 に記載の医薬製剤。

## 【請求項 31】

前記 (R) - 5 - ( ( E ) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジン、またはその薬学的に許容される塩が、レーシック眼科手術の前または後に経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

## 【請求項 32】

前記眼の不快感が、ドライアイ疾患、眼瞼炎、マイボーム腺機能不全、アレルギー性結膜炎、眼表面の毒性及び刺激、涙液排出の問題、または眼瞼障害に関連する、請求項 2 に記載の医薬製剤。

30

## 【請求項 33】

前記それを必要とする個体が、ドライアイ疾患の徴候および症状を有する、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

## 【請求項 34】

(R) - 5 - ( ( E ) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジンが、遊離塩基として経鼻投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

## 【請求項 35】

1 日当たり、1  $\mu$ g ~ 3 mg の (R) - 5 - ( ( E ) - 2 - ピロリジン - 3 - イルビニル ) ピリミジンを経鼻投与することを含む、請求項 34 に記載の医薬製剤。

40

## 【請求項 36】

前記それを必要とする個体がヒトである、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

## 【請求項 37】

前記それを必要とする個体が家畜動物である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

## 【請求項 38】

前記それを必要とする個体が、イヌ、ネコ、またはウサギである、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

50