

【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 25 年 4 月 18 日 (2013.4.18)

【公表番号】特表 2011-515494 (P2011-515494A)

【公表日】平成 23 年 5 月 19 日 (2011.5.19)

【年通号数】公開・登録公報 2011-020

【出願番号】特願 2011-502063 (P2011-502063)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/65 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/08

A 6 1 K 31/65

A 6 1 K 9/06

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 3 月 23 日 (2012.3.23)

【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】

眼瞼縁疾患の処置を必要とする被験体において、眼瞼縁疾患を処置するための局所眼科用組成物であって、

a) 抗炎症特性を含む抗感染剤と；

b) 粘膜付着性ビヒクルと

の組み合わせを含み、該組成物が少なくとも 1 日に 1 回、少なくとも 3 ヶ月まで、該被験体の眼瞼縁に、眼前部に、上眼瞼の下に、下眼瞼上に、涙腺または盲嚢に局所投与されることを特徴とする、局所眼科用組成物。

【請求項 2】

前記抗感染剤がテトラサイクリンファミリー抗生物質である、請求項 1 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 3】

前記テトラサイクリンファミリー抗生物質がドキシサイクリンである、請求項 2 に記載の

局所眼科用組成物。

【請求項 4】

前記テトラサイクリンファミリー抗生物質がテトラサイクリンまたはミノサイクリンである、請求項 2 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 5】

前記粘膜付着性ビヒクルがデキストラン、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリサッカライドゲル、ゲルライト（登録商標）、セルロース性ポリマー、およびカルボキシ含有ポリマー系から成る群より選択されるポリマー性懸濁化剤を含む、請求項 1 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 6】

前記カルボキシ含有ポリマー系が架橋カルボキシ含有ポリマーを含む、請求項 5 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 7】

前記架橋カルボキシ含有ポリマーがポリカルボフィルである、請求項 6 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 8】

前記カルボキシ含有ポリマー系がノベオン A A - 1、カルボボル（登録商標）、デュラサイト（登録商標）、またはその組合せから成る群より選択される、請求項 6 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 9】

前記眼瞼縁疾患が眼瞼炎である、請求項 1 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 10】

前記眼瞼炎が前部形の眼瞼炎である、請求項 9 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 11】

前記眼瞼炎が後部形の眼瞼炎である、請求項 9 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 12】

前記被験体の眼瞼縁に、眼前部に、上眼瞼の下に、下眼瞼上に、涙腺または盲嚢に局所投与された後に、前記組成物が眼瞼にマッサージされることを特徴とする、請求項 1 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 13】

前記組成物が、眼瞼温熱療法、眼瞼衛生維持、栄養補助食品、またはその任意の組合せから成る群より選択される待機治療と併せて前記被験体に投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の局所眼科用組成物。

【請求項 14】

ドライアイ疾患の処置を必要とする被験体において、ドライアイ疾患を処置するための局所眼科用組成物であって、

a) 抗炎症特性を含む抗感染剤と；

b) 粘膜付着性ビヒクルと

の組み合わせを含み、該組成物が少なくとも 1 日に 1 回、少なくとも 3 ヶ月まで、該被験体の眼前部に、上眼瞼の下に、下眼瞼上に、涙腺または盲嚢に局所投与されることを特徴とする、局所眼科用組成物。

【請求項 15】

治療剤を被験体のマイボーム腺開口部に送達するための製剤であって：

デキストラン、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリサッカライドゲル、ゲルライト（登録商標）、セルロース性ポリマー、カルボキシ含有ポリマー系、およびその任意の組合せから成る群より選択されるポリマー性懸濁化剤を含む粘膜付着性ビヒクル中の治療剤を含み；

該製剤が、該被験体の眼瞼縁に、眼前部に、上眼瞼の下に、下眼瞼上に、涙腺または盲嚢に投与されること；および

該製剤が、投与後に該被験体の眼瞼にマッサージされることを特徴とする、製剤。

【手続補正 2】**【補正対象書類名】明細書****【補正対象項目名】0006****【補正方法】変更****【補正の内容】****【0006】**

本発明は、例えば、以下を提供する：

(項目1)

眼瞼縁疾患を処置する方法であって、その処置を必要とする被験体に：

a) 抗炎症特性を含む抗感染剤と；

b) 粘膜付着性ビヒクルと

の組み合わせを含む、有効量の局所眼科用組成物を投与することを含み、該組成物が少なくとも1日に1回、少なくとも3ヶ月まで、該被験体の眼瞼縁に、眼前部に、上眼瞼の下に、下眼瞼上に、涙腺または盲嚢に局所投与される、方法。

(項目2)

上記抗感染剤がテトラサイクリンファミリー抗生物質である、項目1に記載の方法。

(項目3)

上記テトラサイクリンファミリー抗生物質がドキシサイクリンである、項目2に記載の方法。

(項目4)

上記テトラサイクリンファミリー抗生物質がテトラサイクリンまたはミノサイクリンである、項目2に記載の方法。

(項目5)

上記粘膜付着性ビヒクルがデキストラン、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリサッカライドゲル、ゲルライト（登録商標）、セルロース性ポリマー、およびカルボキシ含有ポリマー系から成る群より選択されるポリマー性懸濁化剤を含む、項目1に記載の方法。

(項目6)

上記カルボキシ含有ポリマー系が架橋カルボキシ含有ポリマーを含む、項目5に記載の方法。

(項目7)

上記架橋カルボキシ含有ポリマーがポリカルボフィルである、項目6に記載の方法。

(項目8)

上記カルボキシ含有ポリマー系がノベオンAA-1、カルボボル（登録商標）、デュラサイト（登録商標）、またはその組合せから成る群より選択される、項目6に記載の方法。

(項目9)

上記眼瞼縁疾患が眼瞼炎である、項目1に記載の方法。

(項目10)

上記眼瞼炎が前部形の眼瞼炎である、項目9に記載の方法。

(項目11)

上記眼瞼炎が後部形の眼瞼炎である、項目9に記載の方法。

(項目12)

上記被験体の眼瞼縁に、眼前部に、上眼瞼の下に、下眼瞼上に、涙腺または盲嚢に局所投与した後に、眼科用製剤を眼瞼にマッサージすることをさらに含む、項目1に記載の方法。

(項目13)

眼瞼温熱療法、眼瞼衛生維持、栄養補助食品、またはその任意の組合せから成る群より選択される待機治療を、上記局所眼科用組成物と併せて上記被験体に投与することをさらに含む、項目1に記載の方法。

(項目14)

ドライアイ疾患を処置する方法であって、その処置を必要とする被験体に：

a) 抗炎症特性を含む抗感染剤と；

b) 粘膜附着性ビヒクルと

の組み合わせを含む、有効量の局所眼科用組成物を投与することを含み、該組成物が少なくとも1日に1回、少なくとも3ヶ月まで、該被験体の眼前部に、上眼瞼の下に、下眼瞼上に、涙腺または盲嚢に局所投与される、方法。

(項目15)

治療剤を被験体のマイボーム腺開口部に送達する方法であって：

(a) デキストラン、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリサッカライドゲル、ゲルライト（登録商標）、セルロース性ポリマー、カルボキシ含有ポリマー系、およびその任意の組合せから成る群より選択されるポリマー性懸濁化剤を含む粘膜附着性ビヒクル中に治療剤を調合するステップと；

(b) 該被験体の眼瞼縁に、眼前部に、上眼瞼の下に、下眼瞼上に、涙腺または盲嚢にステップ(a)の製剤を投与するステップと；

(c) ステップ(b)の適用後にステップ(a)の製剤を該被験体の眼瞼にマッサージするステップとを含む、方法。

(発明の要旨)

本発明は、マイボーム腺分泌を正常化して（すなわちマイボーム腺分泌物の粘度を低下させ、分泌物の透明性を向上させて、腺分泌の間の時間を短縮する）、眼の不快感を軽減するために相乗的に作用して、それにより眼瞼縁疾患の少なくとも1つの徴候または症状を処置および/または予防することが可能である構成要素の組合せを含む、眼瞼縁機能を改善するのに好適な局所眼科用製剤を提供する。特に、本明細書に記載する製剤は、眼瞼縁疾患およびそれに関連する疾患（たとえばドライアイ疾患、慢性結膜炎（conjunctivitis）、霰粒腫および角膜炎）の処置および/または予防のための間欠的および/または反復長期間使用に好適な粘膜附着性ビヒクル中に、抗感染特性および抗炎症特性の両方を有する広域抗生物質を含む。