

【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 2 年 1 月 23 日 (2020.1.23)

【公表番号】特表 2019-511493 (P2019-511493A)

【公表日】平成 31 年 4 月 25 日 (2019.4.25)

【年通号数】公開・登録公報 2019-016

【出願番号】特願 2018-547415 (P2018-547415)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 33/34 (2006.01)

A 6 1 K 31/525 (2006.01)

A 6 1 K 31/353 (2006.01)

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 K 31/30 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 33/34

A 6 1 K 31/525

A 6 1 K 31/353

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 31/30

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 12 月 6 日 (2019.12.6)

【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】

眼科用組成物であって、

対象者の眼における角膜リシルオキシダーゼ活性を増大させるために十分な量の交差架橋剤と、

薬学的に許容可能な担体と、  
を有する、眼科用組成物。

【請求項 2】

請求項 1 記載の組成物において、前記眼科用組成物は、溶液、懸濁液、ゲル、ヒドロゲル、熱応答性ゲル、デポ、フィルム、及びコンタクトレンズのうちの一つとして製剤化されるものである、組成物。

【請求項 3】

請求項 1 記載の組成物において、前記交差架橋剤は、銅含有性剤を有する、組成物。

【請求項 4】

請求項 3 記載の組成物において、前記銅含有性剤は、約 0.00005 wt % から約 15 wt % の量で存在する、組成物。

【請求項 5】

請求項 3 記載の組成物において、前記組成物中に存在する銅の量が、約 0.0001 mg / ml から約 5 mg / ml の量である、組成物。

【請求項 6】

請求項 3 記載の組成物において、前記銅含有性剤は、硫酸銅、炭酸銅、酢酸銅、塩化銅、グルコン酸銅、臭化銅、フッ化銅、硝酸銅、ヨウ化銅、過塩素酸銅、モリブデン酸銅、チオシアン酸銅、酒石酸銅、テトラフルオロホウ酸銅、セレン化銅、ピロリン酸銅、GHK - 銅、硫酸テトラアミン銅、銅 - ヒスチジン、銅 - グリシン酸、及びこれらの組合せからなる群から選択されるメンバーである、組成物。

【請求項 7】

請求項 1 記載の組成物において、前記薬学的に許容可能な担体は、等張化剤、可溶化剤、増粘剤、ポリマー、緩衝剤、pH 調節剤、及び水のうち少なくとも一つを含む、組成物。

【請求項 8】

請求項 1 記載の組成物において、前記組成物は、約 270 mosm / kg から約 330 mosm / kg の張度を有する、組成物。

【請求項 9】

請求項 1 記載の組成物において、前記組成物は、約 5.8 から約 7.8 の pH を有する、組成物。

【請求項 10】

請求項 1 記載の組成物において、前記組成物は、さらに、追加の有効成分を有する、組成物。

【請求項 11】

請求項 10 記載の組成物において、前記追加の有効成分は、リボフラビン、ローズベンガル、ヒドロキシリシン、及びこれらの組合せからなる群から選択されるメンバーである、組成物。

【請求項 12】

局所用眼科用剤形であって、

点眼剤として製剤化され、かつ前記組成物を約 5  $\mu$ l から約 50  $\mu$ l の滴体積で滴下方式で投薬するように適合した容器中に含まれる、請求項 1 記載の眼科用組成物を有する、剤形。

【請求項 13】

請求項 12 記載の剤形において、前記局所用眼科用組成物は銅含有性剤を有する、剤形。

【請求項 14】

請求項 13 記載の剤形において、前記剤形は、前記眼科用組成物の一滴あたり約 0.0005  $\mu$ g から約 5  $\mu$ g の銅を提供する、剤形。

【請求項 15】

請求項 12 記載の剤形において、前記容器は、約 15  $\mu$ l から約 40  $\mu$ l の滴体積で前記組成物を投薬するように適合される、剤形。

【請求項 16】

治療期間中に治療有効量で対象者の眼に投与する際に眼科的状态を治療するための薬剤

の調整における交差架橋剤の使用であって、

対象者の眼における角膜リシルオキシダーゼ活性を増大させるために十分である交差架橋剤を薬学的に許容可能な担体と組み合わせる、使用。

【請求項 17】

請求項 16 記載の使用において、前記眼科的状态は、円錐角膜、辺縁潰瘍性角膜炎、角膜潰瘍、角膜融解、ペルーシド周辺変性、テリエン周辺角膜変性、神経栄養性角膜炎、及び角膜拡張症のうち少なくとも一つを有する、使用。

【請求項 18】

請求項 16 記載の使用において、前記組成物は、前記組成物を必要とする眼一つあたり、一日 1 つから 4 つの時点で投与される、使用。

【請求項 19】

請求項 18 記載の使用において、約 15  $\mu$ l から約 40  $\mu$ l の前記組成物が各時点で投与される、使用。

【請求項 20】

請求項 16 記載の使用において、前記治療期間は、約 1 ヶ月から約 36 ヶ月の持続する期間である、使用。

【請求項 21】

請求項 16 記載の使用において、前記治療有効量は、治療なしの角膜における交差架橋と比較して、角膜における、リシノールロイシン交差架橋、及び/またはヒスチジニル-ヒドロキシリシノールロイシン交差架橋を増大させる、使用。

【請求項 22】

請求項 16 記載の使用において、前記治療有効量は、治療なしの角膜の求心ストレインと比較して、角膜の求心ストレインを低下させる、使用。

【請求項 23】

請求項 16 記載の使用において、前記治療有効量は、治療なしの角膜ジオブトリーと比較して、角膜ジオブトリーを低下させる、使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0002

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0002】

多くの眼科的状态は、角膜薄化及び角膜の生体力学的衰弱をもたらさう。いくつかの場合においては、角膜の形が改変され得、乱視、光に対する過敏症、及び他の合併症を引き起こす。そのような状態は、円錐角膜、角膜潰瘍、角膜拡張症、ペルーシド周辺変性、及びこれらの類似物を含みうる。

この出願の発明に関連する先行技術文献情報としては、以下のものがある（国際出願日以降国際段階で引用された文献及び他国に国内移行した際に引用された文献を含む）。

（先行技術文献）

（特許文献）

（特許文献 1） 米国特許出願公開第 2006 / 0276777 号明細書

（特許文献 2） 米国特許第 4,490,389 号明細書

（特許文献 3） 米国特許出願公開第 2016 / 0059032 号明細書

（特許文献 4） 米国特許出願公開第 2010 / 0016814 号明細書

（特許文献 5） 米国特許出願公開第 2003 / 0175259 号明細書

（特許文献 6） 米国特許出願公開第 2006 / 0029636 号明細書

（特許文献 7） 米国特許出願公開第 2010 / 0189817 号明細書

（特許文献 8） 米国特許出願公開第 2006 / 0165611 号明細書

（特許文献 9） 米国特許出願公開第 2011 / 0076285 号明細書