

【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18年3月2日(2006.3.2)

【公表番号】特表2005-514428(P2005-514428A)

【公表日】平成17年5月19日(2005.5.19)

【年通号数】公開・登録公報2005-019

【出願番号】特願2003-559245(P2003-559245)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/38

【手続補正書】

【提出日】平成18年1月13日(2006.1.13)

【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】

セルロース誘導体および過酸化水素源を含んでなる水溶性眼用溶液においてクラドスボリウムの増殖を抑制する方法であつて、

クラドスボリウムで汚染された場合、クラドスボリウムが増殖する、セルロース誘導体および過酸化水素源を含んでなる水溶液を提供すること；および

有効な量のアルカリ土類金属塩を前記溶液に混和して、前記溶液がクラドスボリウムで汚染された場合に、アルカリ土類金属塩を含有しないこと以外は同一の溶液と比較してクラドスボリウムの増殖をより少なくするアルカリ土類金属含有溶液を得ることを含んでなる方法。

【請求項2】

更に、前記アルカリ土類金属を含有している溶液のpHを約5.5および約8.0の間に調節することを含んでなる請求項1記載の方法。

【請求項3】

前記過酸化水素源が過酸化水素、過ホウ酸ナトリウム、過酸化ナトリウムおよび過酸化尿素からなる群から選択される請求項2記載の方法。

【請求項4】

前記アルカリ土類金属を含有する溶液が、ジエチレントリアミンペンタ(メチレンホスホン酸)、1-ヒドロキシエチリデン-1,1-ジホスホン酸、およびこれらの生理的適合塩からなる群から選択される一つまたはそれ以上の過酸化水素安定剤を更に含んでなる請求項3記載の方法。

【請求項5】

前記安定剤が 1 - ヒドロキシエチリデン - 1 , 1 - ジホスホン酸またはその生理的適合塩である請求項 4 記載の方法。

【請求項 6】

前記安定剤がジエチレントリアミン ペンタ (メチレンホスホン酸) である請求項 4 記載の方法。

【請求項 7】

前記溶液が約 0 . 0 0 5 % から約 0 . 2 重量 % の 1 - ヒドロキシエチリデン - 1 , 1 - ジホスホン酸またはその生理的適合塩を含んでなる請求項 5 記載の方法。

【請求項 8】

前記溶液が約 0 . 0 0 2 % から約 0 . 0 3 重量 % のジエチレン トリアミン ペンタ (メチレンホスホン酸) またはその生理的適合塩を含んでなる請求項 6 記載の方法。

【請求項 9】

前記セルロース誘導体がヒドロキシプロピルメチルセルロースである請求項 4 記載の方法。

【請求項 10】

前記溶液が約 0 . 1 % から約 0 . 5 重量 % のヒドロキシプロピルメチルセルロースを含んでなる請求項 9 記載の方法。

【請求項 11】

前記溶液が、約 0 . 0 5 % から約 0 . 1 重量 % の溶解したアルカリ土類金属塩を含んでなる請求項 10 記載の方法。

【請求項 12】

前記溶液が、約 0 . 0 5 重量 % の溶解したアルカリ土類金属塩を含んでなる請求項 11 記載の方法。

【請求項 13】

(a) 過酸化水素源

(b) セルロース誘導体

(c) 水 ; および

(d) 前記溶液がクラドスポリウムで汚染された場合に、アルカリ土類金属塩を含有しないこと以外は同一の溶液と比較して前記溶液においてより少ないクラドスポリウムの増殖がおこるように、有効な量のアルカリ土類金属塩を含んでなる眼用溶液。

【請求項 14】

更に、pHを約 5 . 5 および約 8 . 0 の間に調節することを含んでなる請求項 13 記載の溶液。

【請求項 15】

前記過酸化水素源が過酸化水素、過ホウ酸ナトリウム、過酸化ナトリウムおよび過酸化尿素からなる群から選択される請求項 13 記載の溶液。

【請求項 16】

一つまたはそれ以上の過酸化水素安定剤が、ジエチレン トリアミン ペンタ (メチレンホスホン酸) または 1 - ヒドロキシエチリデン - 1 , 1 - ジホスホン酸、およびこれらの生理的適合塩からなる群から選択される請求項 15 記載の溶液。

【請求項 17】

前記セルロース誘導体がヒドロキシプロピルメチルセルロースである請求項 16 記載の溶液。

【請求項 18】

前記溶液が約 0 . 1 % から約 0 . 5 重量 % のヒドロキシプロピルメチルセルロースを含んでなる請求項 17 記載の溶液。

【請求項 19】

前記溶液が、約 0 . 0 5 % から約 0 . 1 重量 % の溶解したアルカリ土類金属塩を含んでなる請求項 18 記載の溶液。

【請求項 20】

約 0.2 重量 % のヒドロキシプロピルメチルセルロース、約 0.27 重量 % の塩化ナトリウム、約 0.12 重量 % の塩化カリウム、約 0.5 重量 % のホウ酸、約 0.05 重量 % の塩化カルシウム二水和物、約 0.006 重量 % のジエチレントリアミン ペンタ(メチレン ホスホン酸)、および約 0.028 重量 % の過ホウ酸ナトリウム四水和物を含んでおり、該溶液の pH が約 6.8 から約 7.0 の間である請求項 19 記載の水溶液。

【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】

より詳しくは、本発明は、セルロース誘導体および過酸化水素源 (hydrogen peroxide source) を含んでなる水溶性眼用溶液のクラドスボリウムの増殖を抑制する方法であって

クラドスボリウムで汚染された場合、クラドスボリウムが増殖する、セルロース誘導体および過酸化水素源を含んでなる水溶液を提供すること；および

有効な量のアルカリ土類金属塩を前記溶液に混和して、前記溶液がクラドスボリウムで汚染された場合に、アルカリ土類金属塩を含有しないこと以外は同一の溶液と比較してクラドスボリウムの増殖をより少なくするアルカリ土類金属含有溶液を得ることを含んでなる方法に関する。

【手続補正 3】

【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】

過酸化水素源は、好ましくは、約 0.045 重量 % で、より好ましくは、約 0.035 重量 % までそして、もっとも好ましくは約 0.028 重量 % までの有効な量で用いられる。適切な過酸化水素源の量は、たとえば、0.001 % から約 0.01 重量 % の、好ましくは、0.001 から 0.0075 % の、より好ましくは 0.001 % から 0.062 % の、たとえば、0.001 から 0.0025 % の安定化された保存剤としての過酸化水素を含む水溶液を作成する。本発明によって保存される場合、たいていの化合物は微量の過酸化水素に適合すると信じられている。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0008】

水溶性眼用溶液は、眼科用の粘滑剤 (demulcent) を含有する溶液または、眼科用の活性剤を含有する溶液であり得る。本明細書で使用される眼科用の活性剤は、眼に局所的に投与された場合に、眼に医薬効果を与える化合物である。次に掲げるものは、本発明の保存剤と適合性があり、排他的でなく、それらに制限されるものでもない、眼科用有効成分および賦形剤の例証である。すなわち、アトロピン、ホマトロピン、シクロペントラート、トロピカミド、ラケシン (lachesine)、ジブトリン (dibutoline)、オキシフェノニウム、ユーカトロピン (eucatropine)、エフェドリン、カルバコール、メタコリン、塩酸ピロカルピン、イソフルロフェート、フィソスチグミン、ネオスチグミン、リグノカイシン (lignocaine)、コカイン、アセチルコリンクロリド、アンタゾリンフォスフェート、塩酸ベタキソロール、デメカリウムプロミド、塩酸ジピベフリン、エリスロマイシン、硫

酸ゲンタマイシン、臭化水素酸ホマトロピン、イドクスウリジン、イソソルビド、ラノリン、ケトチフェンヒドロジエンフマレート (ketotifen hydrogen fumarate)、塩酸ナファゾリン、硫酸ネオマイシン、フェニラミンマレエート、ポリソルベートゼラチン (Tween)、ピリラミンマレエート (pyrilamine maleate)、臭化水素酸スコポラミン、ヒアルロン酸、ヒアルロン酸ナトリウム、塩酸テトラカイン、オキシメタゾリン、塩酸テトラヒドロゾリン、ジクロフェナクナトリウム、デキストラン、カルテオロール、スルファニルアミド、プロカイン、塩酸プロパラカイン、スルフィゾキサゾールジソラミン、インドメタシン、クロニジン、コリナンチン、アラキドン酸、リノール酸、イノシトールトリホスフェート、イノシトールホスフェート、ホスファチジルイノシトール、ホスファチジルイノシトールホスフェートである。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0031

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0031】

5 ml の溶液に真菌 (fungi) を接種し、接種から 10、21 および 31 日後に真菌の存在 / 増殖をアッセイする。溶液 (2) および (3) において、接種と 10 日目の間で増殖がいくらか存在する。溶液 (1) は、すべての時点において真菌コロニー (fungal colonies) の大量の増殖を示す。しかしながら、21 日目までには、生存可能な真菌は溶液 (2) および (3) からは、回収可能ではなく、また 31 日目では、生存可能な真菌は、溶液 (2) または (3) からは回収可能ではない。したがって、塩化カルシウム二水和物を 0.01 および 0.1 % の濃度で添加すると、効果的に真菌の増殖を阻止するが、そうしない場合は、過酸化物で保存された溶液は、真菌の増殖が可能であるであろう。