(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2011 年 9 月 1 日(01.09.2011)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2011/104981 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/5383 (2006.01) *A61P 31/04* (2006.01)
A61P 27/02 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2010/072685

(22) 国際出願日: 2010 年 12 月 16 日(16.12.2010)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2010-040281 2010 年 2 月 25 日(25.02.2010) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 参天製薬株式会社 (SANTEN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5338651 大阪府大阪市東淀川区下新庄三丁目９番１９号 Osaka (JP). 第一三共株式会社 (DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 長野 敬 (NAGANO, Takashi) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 阪中 浩二 (SAKANAKA, Koji) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 中村 雅胤 (NAKAMURA, Masatsugu) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 河津 剛一 (KAWAZU, Kouichi) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 伊吹 肇 (IBUKI, Hajime) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 坂本 佳代子 (SAKAMOTO, Kayoko) [JP/JP]; 〒5338651 大阪府大阪市東淀川区下新庄３丁目９番１９号 参天製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 特許業務法人深見特許事務所 (Fukami Patent Office, p.c.); 〒5300005 大阪府大阪市北区中之島二丁目２番７号 中之島セントラルタワー Osaka (JP).

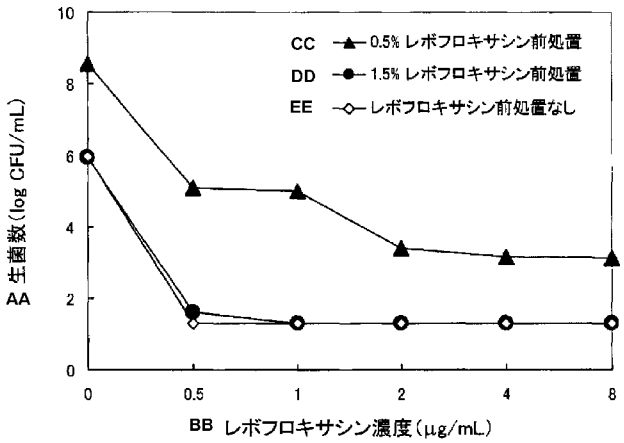
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

[続葉有]

(54) **Title**: EYE DROPS FOR TREATING EYE INFECTION CONTAINING LEVOFLOXACIN, SALT THEREOF OR SOLVATE OF SAME, METHOD FOR TREATING EYE INFECTION, LEVOFLOXACIN, SALT THEREOF OR SOLVATE OF SAME, AND UTILIZATION THEREOF

(54) 発明の名称 : レボフロキサシンもしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含有する眼感染症治療用点眼剤、眼感染症の治療方法、レボフロキサシンもしくはその塩またはそれらの溶媒和物、ならびにその使用

[図2]



AA VIABLE BACTERIAL COUNT (log CFU/mL)
BB LEVOFLOXACIN CONCENTRATION (μg/mL)
CC PRETREATED WITH 0.5% LEVOFLOXACIN
DD PRETREATED WITH 1.5% LEVOFLOXACIN
EE NOT PRETREATED WITH LEVOFLOXACIN

(57) **Abstract**: Disclosed are a method and dosage of eye drops containing 1.5% (w/v) of levofloxacin, characterized in that, when the eye drops are dropped into the eyes thrice a day, bacterial conjunctivitis can be healed within a short period of time, compared with the conventional case where 0.5% (w/v) eye drops are used thrice a day, without increasing the incidence of side effects. Healing of an eye infection within a short period of time contributes to shortening of the exposure time of a pathogenic bacterium causing the eye infection to levofloxacin. As a result, it is expected that, when used in the aforesaid method and dosage, the levofloxacin-containing eye drops inhibit the appearance of a resistant strain which is caused by the prolonged usage of levofloxacin-containing eye drops in the conventional method or dosage. Moreover, it is confirmed that, when used in the aforesaid method and dosage, the levofloxacin-containing eye drops directly inhibit the appearance of resistance, which is caused by the short-term usage of levofloxacin-containing eye drops in the conventional method or dosage, in pathogenic bacteria causative of eye infections such as *Staphylococcus aureus*.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2011/104981 A1

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）

本発明の用法または用量である１．５％（ｗ／ｖ）レボフロキサシン点眼液の１日３回点眼は、従来の用法または用量である０．５％（ｗ／ｖ）点眼液の１日３回点眼よりも短期間で細菌性結膜炎を治癒し、しかも副作用の発現率も増大させないという特徴を併せもつ。短期間で眼感染症を治癒させることは眼感染症起炎菌のレボフロキサシンへの曝露期間を短縮することになることから、本発明の用法または用量のレボフロキサシン点眼液は、結果として、従来の用法または用量のレボフロキサシン点眼液の長期使用を原因とする耐性菌の出現を抑制することが期待される。また、本発明の用法または用量のレボフロキサシン点眼液は、従来の用法または用量のレボフロキサシン点眼液の短期使用を原因とする黄色ブドウ球菌等の眼感染症起炎菌の耐性化を直接的に抑制することが確認された。