(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
2013 年 10 月 3 日(03.10.2013)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2013/146649 A1

(51) 国際特許分類:
*A61K 31/7084* (2006.01) *A61K 47/12* (2006.01)
*A61K 9/08* (2006.01) *A61K 47/24* (2006.01)
*A61K 47/04* (2006.01) *A61P 27/02* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2013/058519

(22) 国際出願日: 2013 年 3 月 25 日(25.03.2013)

(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 2012-069157 2012 年 3 月 26 日(26.03.2012) JP

(71) 出願人: 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).

(72) 発明者: 坂谷 明子(SAKATANI, Akiko); 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 池井 辰夫(IKEI, Tatsuo); 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 稲垣 孝司(INAGAKI, Koji); 〒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); 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 細井 一弘(HOSOI, Kazuhiro); 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 齊藤 美貴子(SAITO, Mikiko); 〒6300101 奈良県生駒市高山町８９１６－１６ 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 園田 雅樹(SONODA, Masaki); 〒5338651 大阪府大阪市東淀川区下新庄三丁目９番１９号 参天製薬株式会社内 Osaka (JP). 福井 陽子(FUKUI, Yoko); 〒5338651 大阪府大阪市東淀川区下新庄三丁目９番１９号 参天製薬株式会社内 Osaka (JP). 桑野 光明(KUWANO, Mitsuaki); 〒5338651 大阪府大阪市東淀川区下新庄三丁目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).

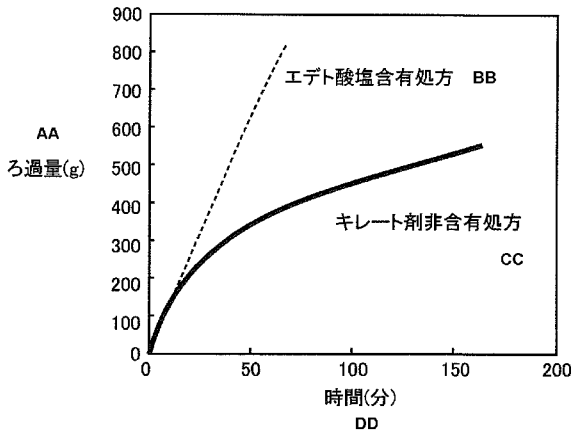
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG,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

[続葉有]

(54) **Title**: DIQUAFOSOL-CONTAINING EYE DROP

(54) 発明の名称 : ジクアホソル含有点眼液

FIG.1




AA Filtration amount (g)
BB Formulation containing edetate
CC Formulation containing no chelating agent
DD Time (min)

(57) **Abstract**: In a diquafosol eye drop containing a chelating agent at a concentration of 0.0001 to 1% (w/v), the production of insoluble precipitates during storage, which is usually observed in a diquafosol eye drop, and the deterioration in filtering performane during a production process (a filter sterilization process) can be prevented. In a diquafosol eye drop containing a chelating agent, the reduction in eye irritation and the improvement in preservative efficacy compared with those in a diquafosol eye drop that does not contain any chelating agent are observed. Therefore, in the present invention, stable physicochemical properties can be achieved during the course of production and distribution and during the course of storage by a patient, and the reduction in eye irritation and the improvement in preservative efficacy are observed. Particularly in a diquafosol eye drop containing a chelating agent, the deterioration in filtering performance during a production process (a filter sterilization process) is prevented. Therefore, highly efficient filter sterilization can be achieved during the course of production, which contributes to the reduction in production cost.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2013/146649 A1

SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(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, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, 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)）

０．０００１～１％（ｗ／ｖ）の濃度のキレート剤を含有するジクアホソル点眼液では、ジクアホソル点眼液で認められる保存中の不溶性析出物の発生、および製造過程（ろ過滅菌過程）におけるろ過性の低下が抑制された。また、キレート剤を含有するジクアホソル点眼液では、キレート剤を含有しないジクアホソル点眼液に比して、眼刺激性の軽減および保存効力の増強も確認された。したがって、本発明は、製造および流通過程ならびに患者による保存過程においても安定した物理化学的性質を有する上、眼刺激性の軽減および保存効力の増強も確認された。特に、キレート剤を含有するジクアホソル点眼液は、製造過程（ろ過滅菌過程）におけるろ過性の低下が抑制されているため、製造過程では効率的なろ過滅菌が可能であり、製造コストの抑制に寄与する。