(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
2012 年 7 月 5 日(05.07.2012)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2012/090994 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/7084 (2006.01) *A61K 47/18* (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01) *A61K 47/24* (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01) *A61P 27/02* (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2011/080179

(22) 国際出願日: 2011 年 12 月 27 日(27.12.2011)

(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 2010-291463 2010 年 12 月 28 日(28.12.2010) 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).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 坂谷 明子(SAKATANI, Akiko) [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). 池井 辰夫(IKEI, Tatsuo) [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). 稲垣 孝司(INAGAKI, 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). 園田 雅樹(SONODA, Masaki) [JP/JP]; 〒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) [JP/JP]; 〒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) [JP/JP]; 〒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).

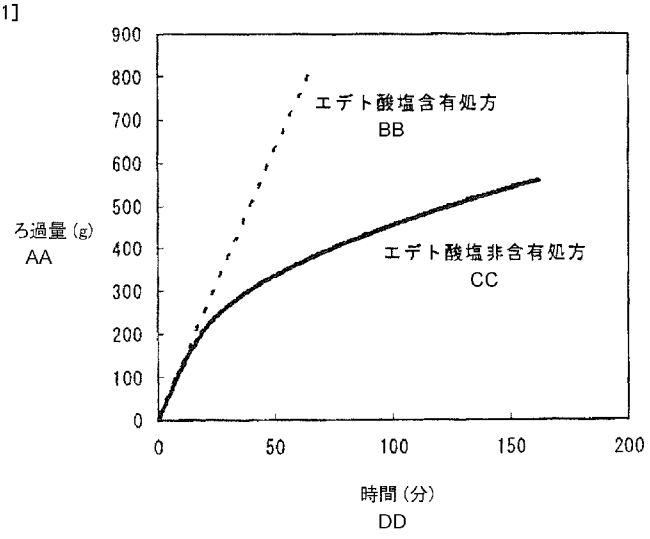
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK,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

(54) 発明の名称 : ジクアホソル含有点眼液およびその製造方法、不溶性析出物発生の抑制方法

[図1]



AA Amount (g) of filtrate
BB Formulation containing edetate
CC Formulation containing no edetate
DD Time (min)

(57) **Abstract**: An ophthalmic solution containing diquafosol to which a chelating agent is added, wherein the formation of an insoluble precipitate during storage and a lowering in filtration performance in a production process (a filtration/sterilization process), said insoluble precipitate formation and said lowering in filtration performance being observed in conventional ophthalmic solutions containing diquafosol, are inhibited. It is also confirmed that the ophthalmic solution containing diquafosol to which a chelating agent is added shows an improved ability to retain the effect during storage. Therefore, the present invention provides an ophthalmic solution containing diquafosol, said ophthalmic solution having stable physicochemical properties in the course of production, distribution and storage by a patient, in particular, enabling efficient filtration/sterilization in the production process, and, moreover, having an excellent ability to retain the effect during storage. Also, the present invention provides a method for preventing the formation of an insoluble precipitate from an aqueous ophthalmic solution containing diquafosol or a salt thereof, said method comprising adding a chelating agent to the aqueous ophthalmic solution.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2012/090994 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, RW, 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)）

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、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し、特に製造過程では効率的なろ過滅菌が可能な上、優れた保存効力をも有するジクアホソル点眼液を提供する。また本発明は、ジクアホソルまたはその塩を含有する水性点眼液に、キレート剤を加えることによる、該水性点眼液から不溶性析出物の発生を抑制する方法についても提供する。