

【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11月12日(2020.11.12)

【公開番号】特開2018-87229(P2018-87229A)

【公開日】平成30年6月7日(2018.6.7)

【年通号数】公開・登録公報2018-021

【出願番号】特願2018-26459(P2018-26459)

【国際特許分類】

A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 K	31/4709	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/40	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/44	(2017.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/22	(2006.01)
A 6 1 K	47/61	(2017.01)
A 6 1 K	47/34	(2017.01)
A 6 1 K	31/517	(2006.01)
A 6 1 K	31/5025	(2006.01)
A 6 1 K	31/4706	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/416	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	9/14			
A 6 1 K	45/00			
A 6 1 P	43/00	1	1	1
A 6 1 P	27/02			
A 6 1 K	31/4709			
A 6 1 K	47/12			
A 6 1 K	47/10			
A 6 1 K	47/26			
A 6 1 K	47/18			
A 6 1 K	47/14			

A 6 1 K	47/40
A 6 1 P	9/10
A 6 1 P	35/00
A 6 1 P	27/06
A 6 1 P	27/04
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	47/04
A 6 1 K	47/44
A 6 1 K	47/24
A 6 1 K	47/22
A 6 1 K	47/61
A 6 1 K	47/34
A 6 1 K	31/517
A 6 1 K	31/5025
A 6 1 K	31/4706
A 6 1 K	31/519
A 6 1 K	31/416
A 6 1 K	31/5377
A 6 1 K	9/10

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月1日(2020.10.1)

【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】

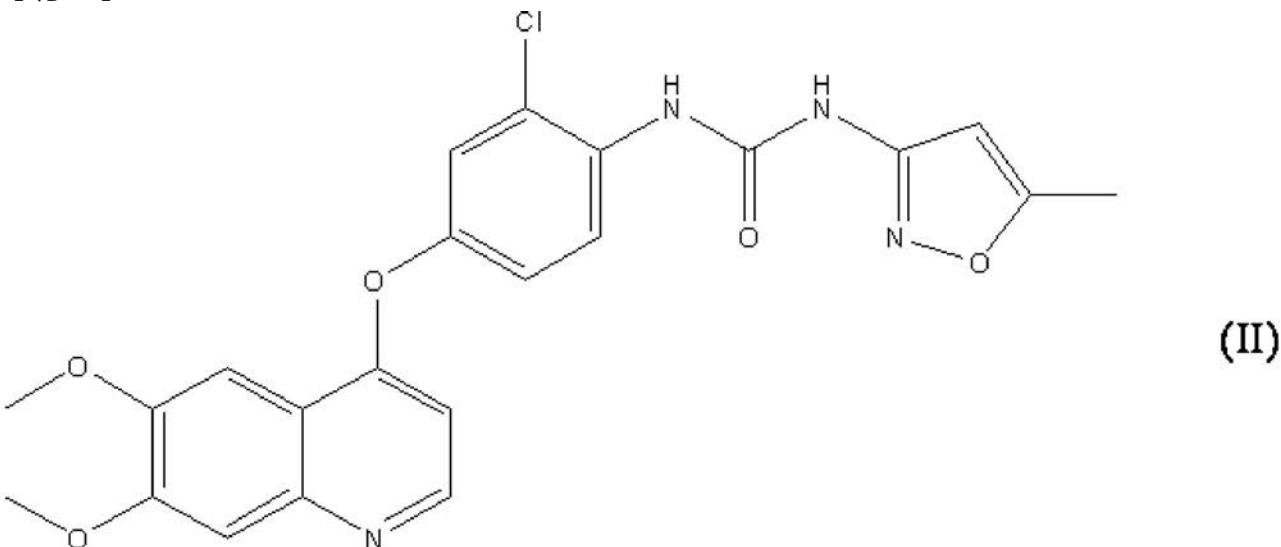
【請求項1】

点眼剤を製造するための凍結乾燥物であって、

前記凍結乾燥物が、ナノ粒子の形態の、血管内皮増殖因子(VEGF)受容体阻害剤を含み

、
VEGF受容体阻害剤が、式(II)

【化1】



で表される化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩、またはそれらの水和物もしくは溶

媒和物である、前記凍結乾燥物。

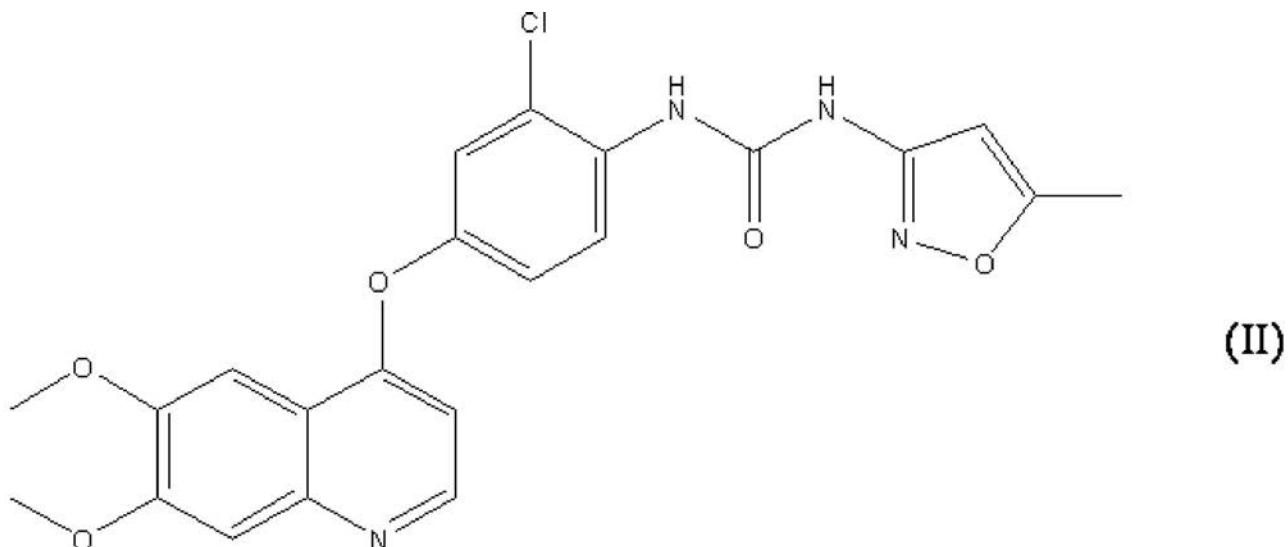
【請求項 2】

点眼剤の製造における凍結乾燥物の使用であって、

前記凍結乾燥物が、ナノ粒子の形態の、血管内皮増殖因子（VEGF）受容体阻害剤を含み、

VEGF受容体阻害剤が、式（II）

【化 2】



で表される化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩、またはそれらの水和物もしくは溶媒和物である、前記使用。

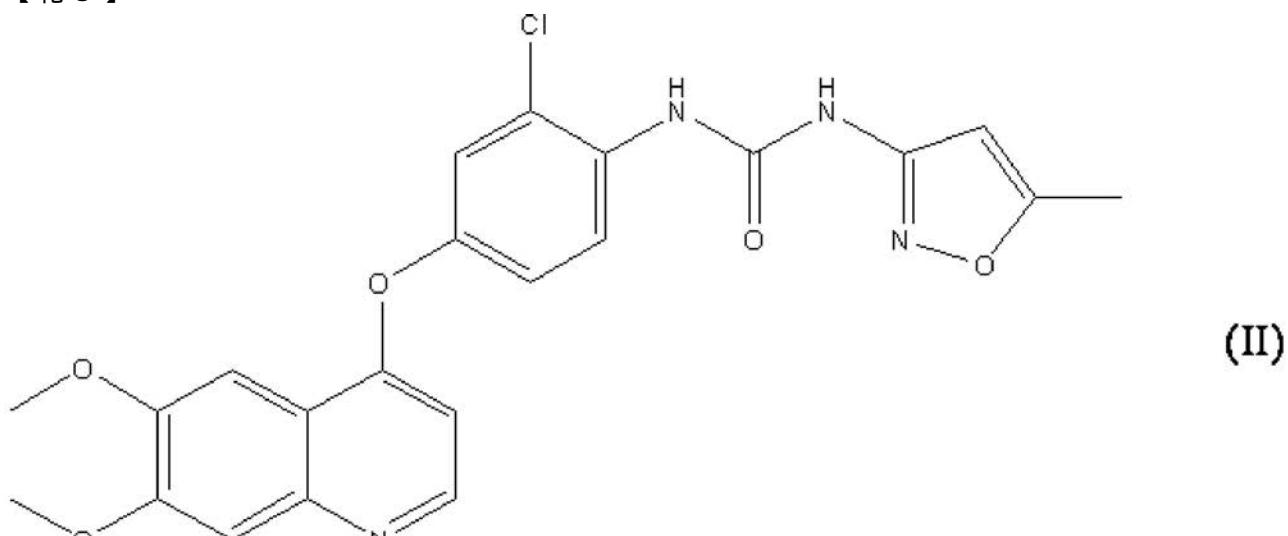
【請求項 3】

凍結乾燥物を分散媒に分散することを含む、点眼剤の製造方法であって、

前記凍結乾燥物が、ナノ粒子の形態の、血管内皮増殖因子（VEGF）受容体阻害剤を含み、

VEGF受容体阻害剤が、式（II）

【化 3】



で表される化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩、またはそれらの水和物もしくは溶媒和物である、前記製造方法。

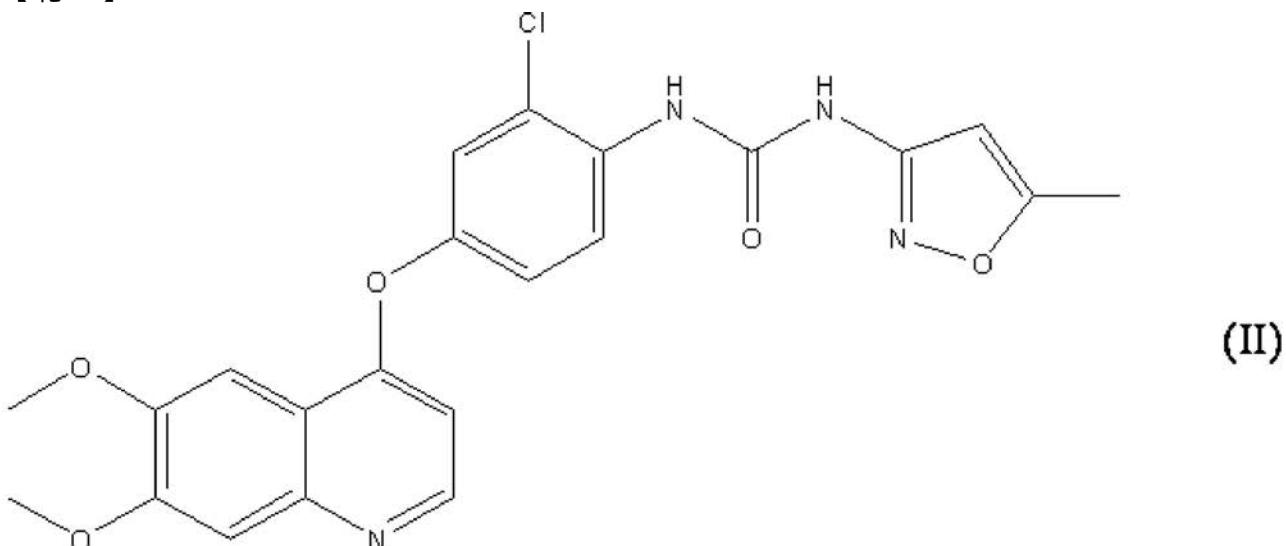
【請求項 4】

点眼剤を製造するための凍結乾燥物であって、

前記凍結乾燥物が、血管内皮増殖因子（VEGF）受容体阻害剤を含み、

VEGF受容体阻害剤が、式（II）

【化4】



で表される化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩、またはそれらの水和物もしくは溶媒和物であり、

前記凍結乾燥物から製造される点眼剤に含まれる前記VEGF受容体阻害剤がナノ粒子の形態である、前記凍結乾燥物。

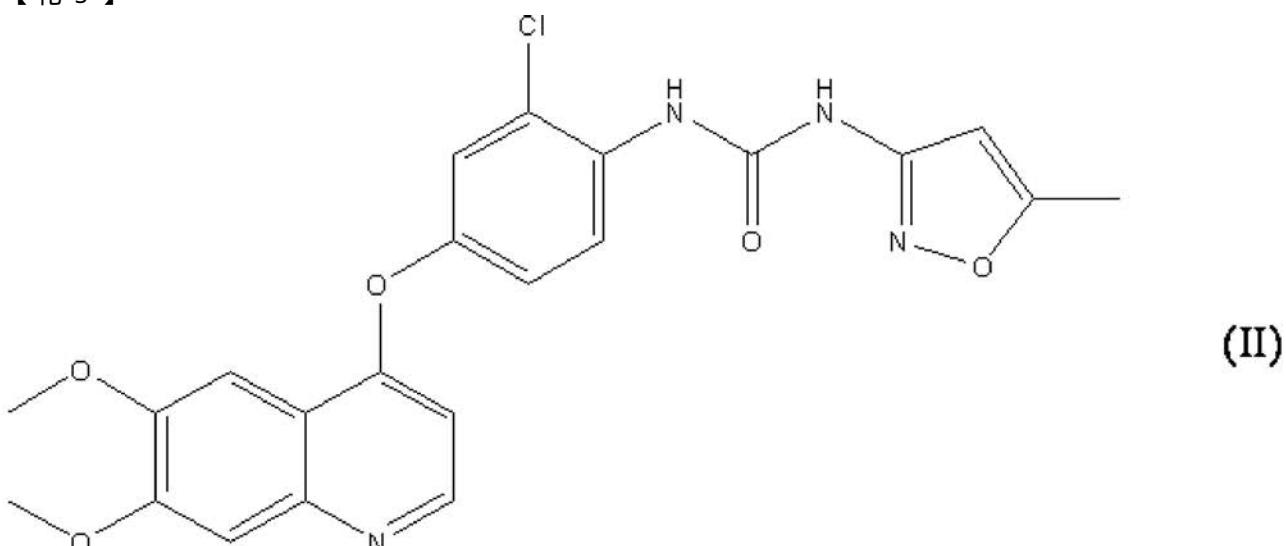
【請求項5】

点眼剤の製造における凍結乾燥物の使用であって、

前記凍結乾燥物が、血管内皮増殖因子（VEGF）受容体阻害剤を含み、

VEGF受容体阻害剤が、式（II）

【化5】



で表される化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩、またはそれらの水和物もしくは溶媒和物であり、

前記凍結乾燥物から製造される点眼剤に含まれる前記VEGF受容体阻害剤がナノ粒子の形態である、前記使用。

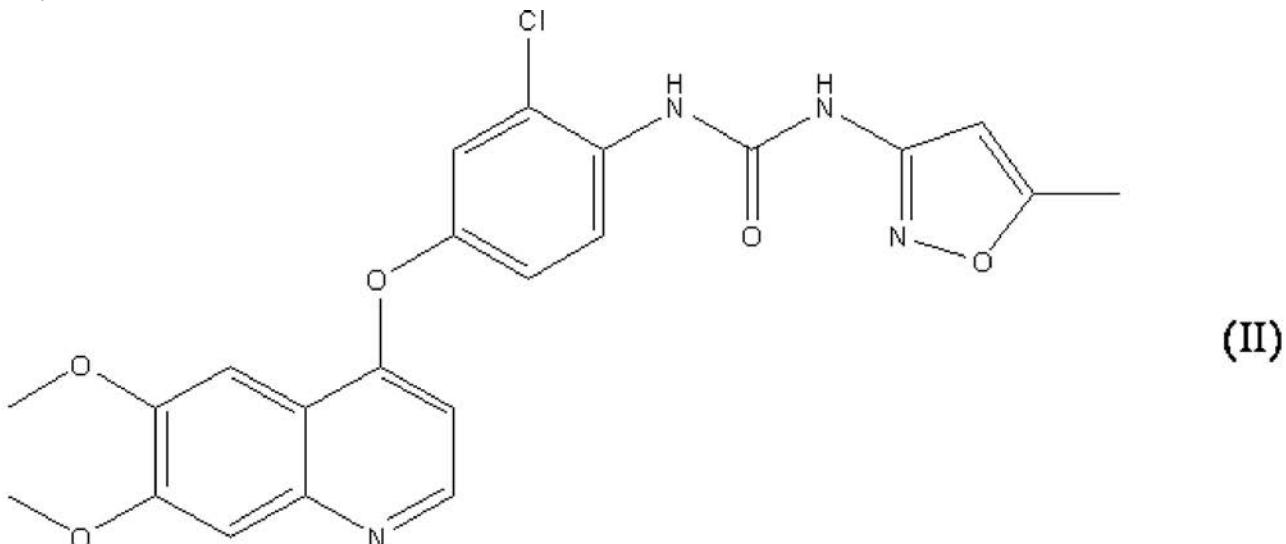
【請求項6】

凍結乾燥物を分散媒に分散することを含む、点眼剤の製造方法であって、

前記凍結乾燥物が、血管内皮増殖因子（VEGF）受容体阻害剤を含み、

VEGF受容体阻害剤が、式（II）

【化6】



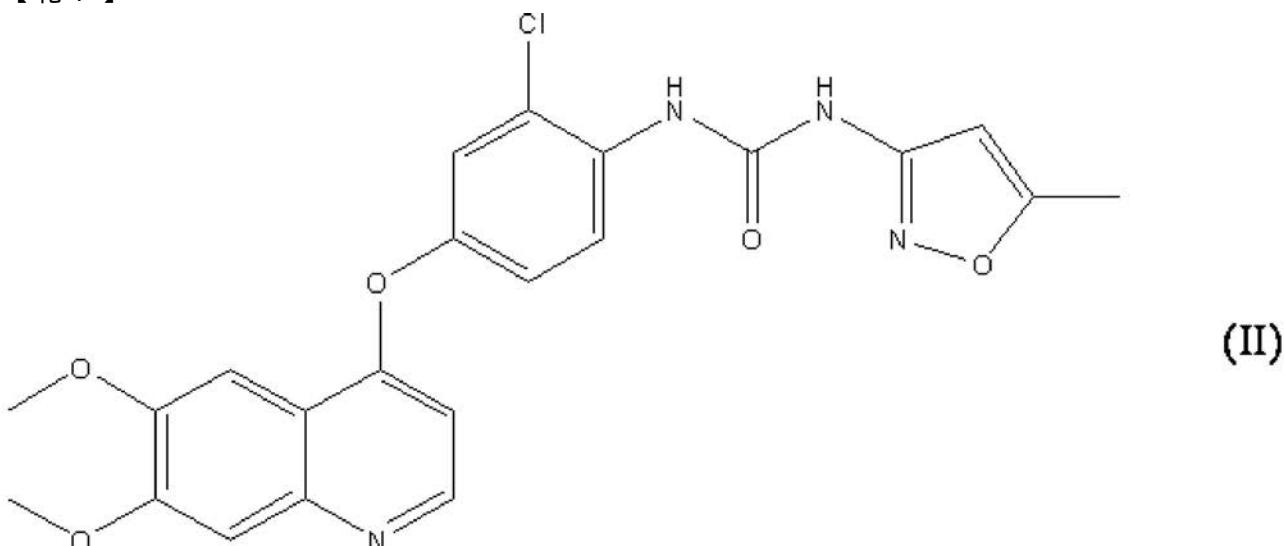
で表される化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩、またはそれらの水和物もしくは溶媒和物であり、

前記点眼剤に含まれる前記VEGF受容体阻害剤がナノ粒子の形態である、前記製造方法。

【請求項7】

ナノ粒子の形態の、血管内皮増殖因子（VEGF）受容体阻害剤を含み、
VEGF受容体阻害剤が、式（II）

【化7】



で表される化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩、またはそれらの水和物もしくは溶媒和物であり、

VEGF受容体阻害剤の含有量が、点眼剤100重量部に対して、0.01～10重量部である、点眼剤。

【請求項8】

VEGF受容体阻害剤が、前記式（II）で表される化合物の薬学的に許容可能な塩である、
請求項7に記載の点眼剤。

【請求項9】

VEGF受容体阻害剤の平均粒子径が400 nm以下である、請求項7又は8に記載の点眼剤。

【請求項10】

VEGF受容体阻害剤の平均粒子径が10～300nmである、請求項7又は8に記載の点眼剤。

【請求項11】

VEGF受容体阻害剤の平均粒子径が10～200nmである、請求項7又は8に記載の点眼剤。

【請求項12】

さらに、粘稠化剤、界面活性剤および分散媒から選ばれる1以上の成分を含む、請求項7～11のいずれかに記載の点眼剤。

【請求項13】

粘稠化剤が、カルボキシビニルポリマー、カルボキシメチルセルロースカルシウム、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ポビドン、部分けん化ポリビニルアルコール、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、ヒドロキシエチルセルロース、非晶質セルロース、メチルセルロース、ケイ酸アルミニウムマグネシウムおよびトリエタノールアミンから選ばれる1以上の物質である、請求項12に記載の点眼剤。

【請求項14】

分散媒が、水、アルコール、流動パラフィン、溶質を含む水、溶質を含むアルコールまたは溶質を含む流動パラフィンである、請求項12または13に記載の点眼剤。

【請求項15】

溶質が、塩化ナトリウム、グルコース、グリセロール、マンニトール、リン酸二水素ナトリウム、リン酸水素ナトリウム水和物、炭酸水素ナトリウム、トリスヒドロキシメチルアミノメタン、クエン酸水和物、ホウ酸、ホウ砂およびリン酸から選ばれる1以上の物質である、請求項14に記載の点眼剤。

【請求項16】

さらに、防腐剤および包接物質から選ばれる1以上の成分を含む、請求項7～15のいずれかに記載の点眼剤。

【請求項17】

防腐剤が、塩化ベンザルコニウム、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、クロロブタノール、エデト酸ナトリウム水和物、クロルヘキシジングルコン酸塩およびソルビン酸から選ばれる1以上の物質である、請求項16に記載の点眼剤。

【請求項18】

点眼剤の形状が、懸濁製剤である、請求項7～17のいずれかに記載の点眼剤。

【請求項19】

点眼剤が眼科疾患治療剤であり、前記眼科疾患が、滲出型加齢性黄斑変性、萎縮型加齢性黄斑変性、脈絡膜新生血管、病的近視における脈絡膜新生血管、網膜静脈分枝閉塞症、黄斑浮腫、網膜中心静脈閉塞症に伴う黄斑浮腫、糖尿病黄斑浮腫、増殖性糖尿病網膜症、血管新生緑内障、網膜色素線条症、未熟児網膜症、Coats病、網膜静脈分枝閉塞症、網膜中心静脈閉塞症、囊腫状黄斑浮腫、糖尿病網膜症による硝子体内出血、イールズ病、中心性漿液性脈絡網膜症、網膜上膜、ブドウ膜炎、多巣性脈絡膜炎、前部虚血性視神経症、角膜血管新生、翼状片、眼内黒色腫、グリオーマ後天性網膜血管腫、放射線網膜症、結節性硬化症、グリオーマ後天性網膜血管腫、結膜扁平上皮癌または高眼圧症である、請求項7～18のいずれかに記載の点眼剤。