

【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】

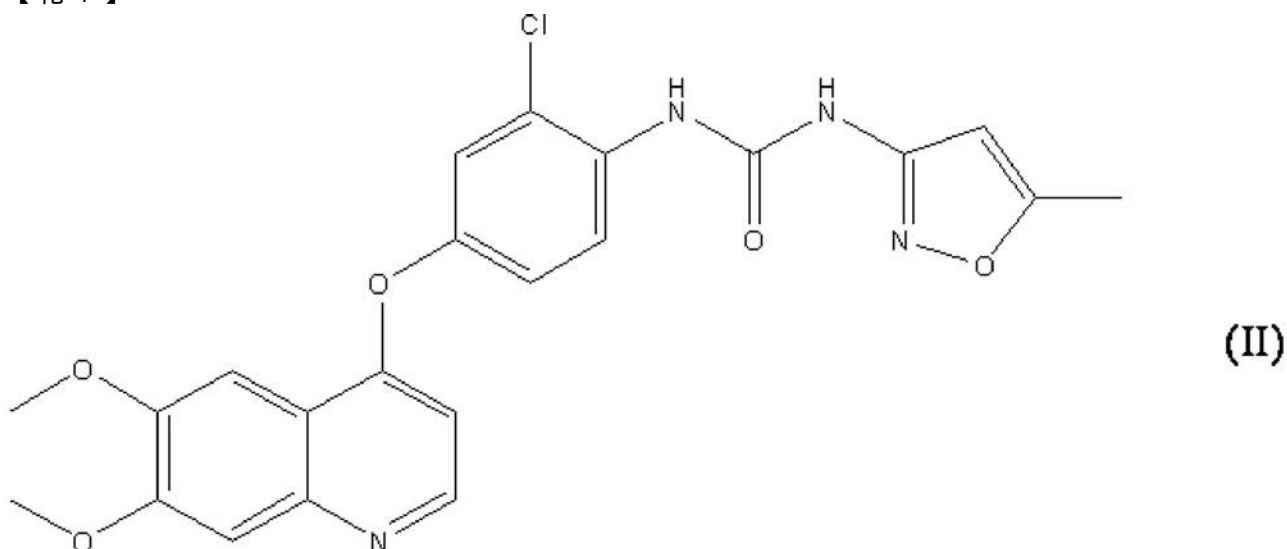
【特許請求の範囲】

【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】



(II)

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】

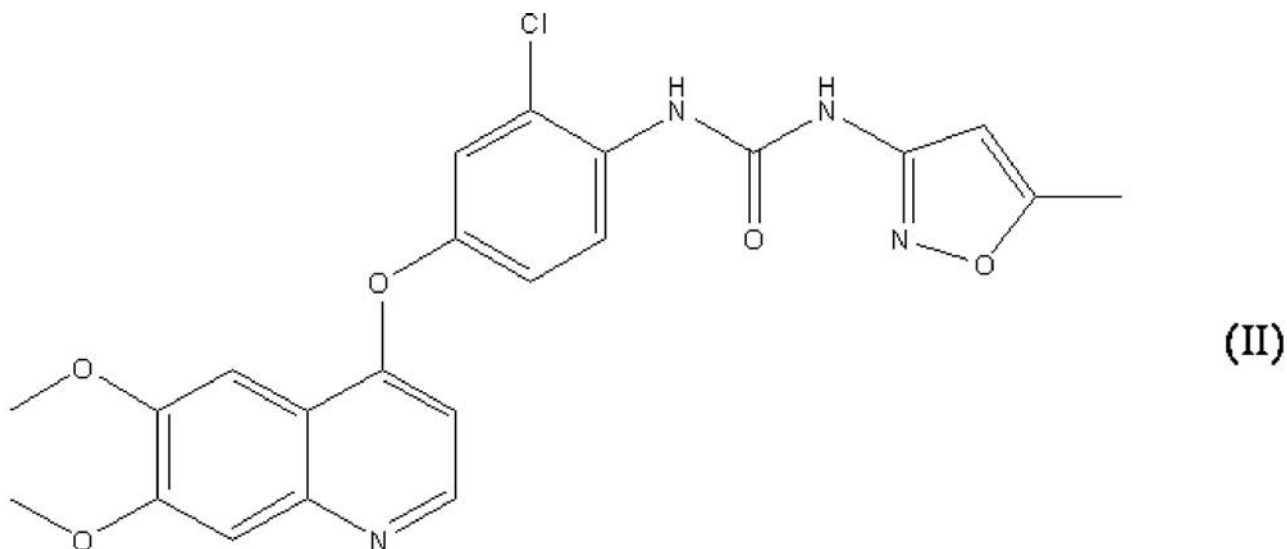
点眼剤の製造における凍結乾燥物の使用であって、

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】

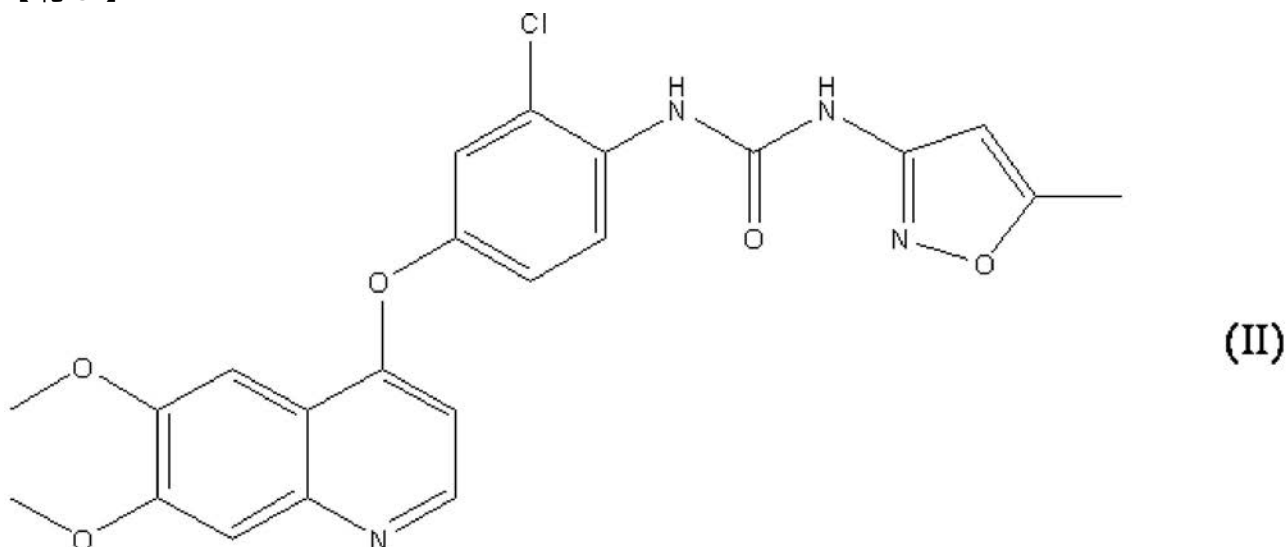
凍結乾燥物を分散媒に分散することを含む、点眼剤の製造方法であって、

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。

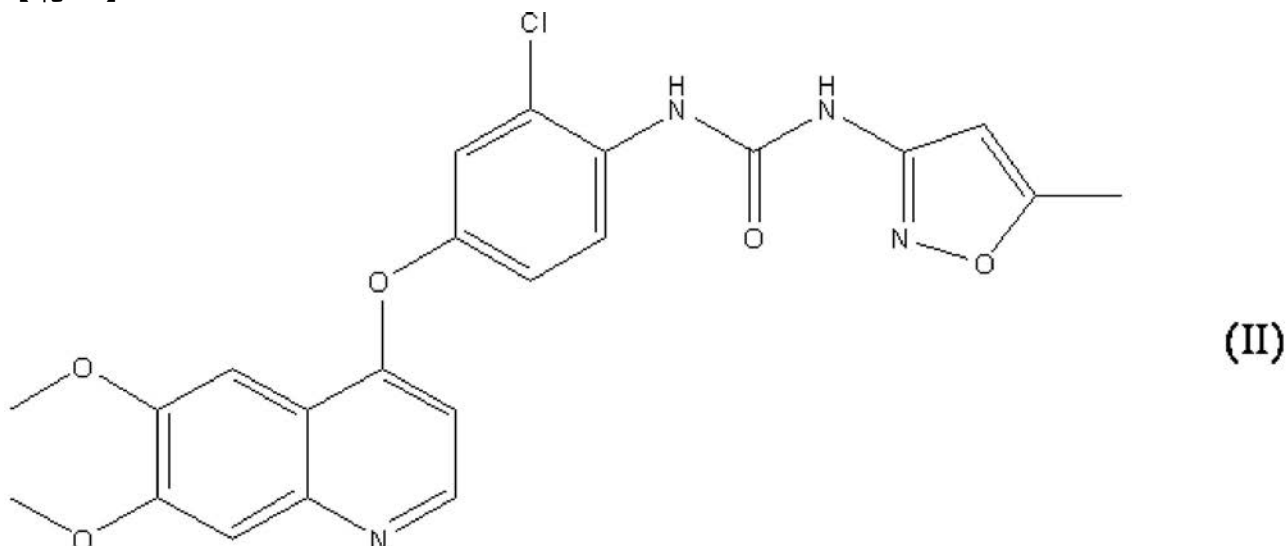
【請求項 4】

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、

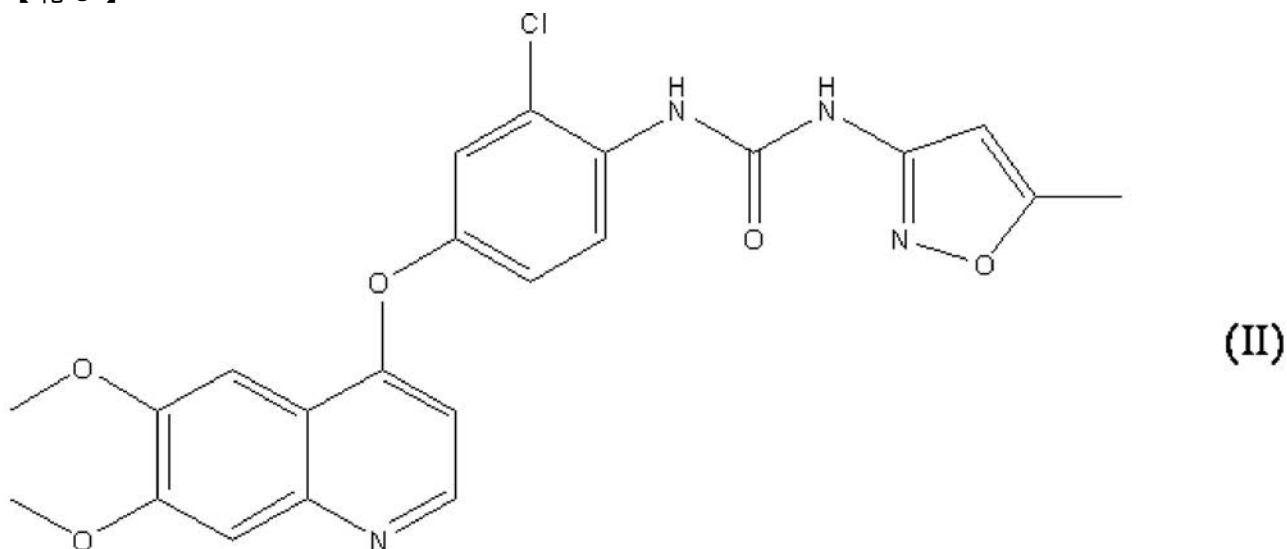
前記凍結乾燥物から製造される点眼剤に含まれる前記VEGF受容体阻害剤がナノ粒子の形態である、前記凍結乾燥物。

【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、

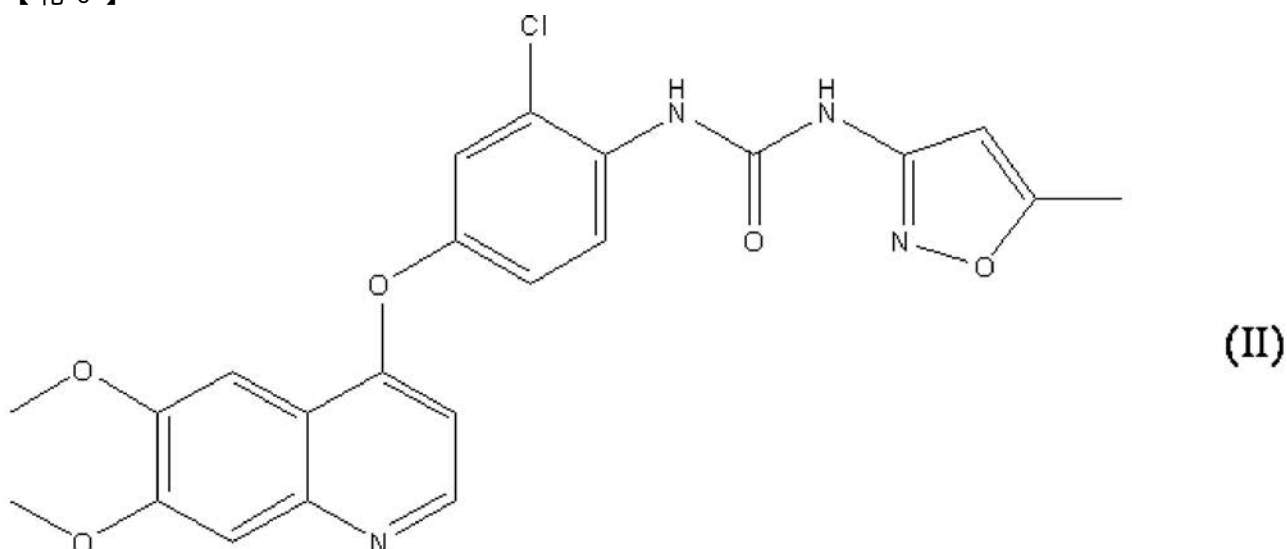
前記凍結乾燥物から製造される点眼剤に含まれる前記VEGF受容体阻害剤がナノ粒子の形態である、前記使用。

【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】



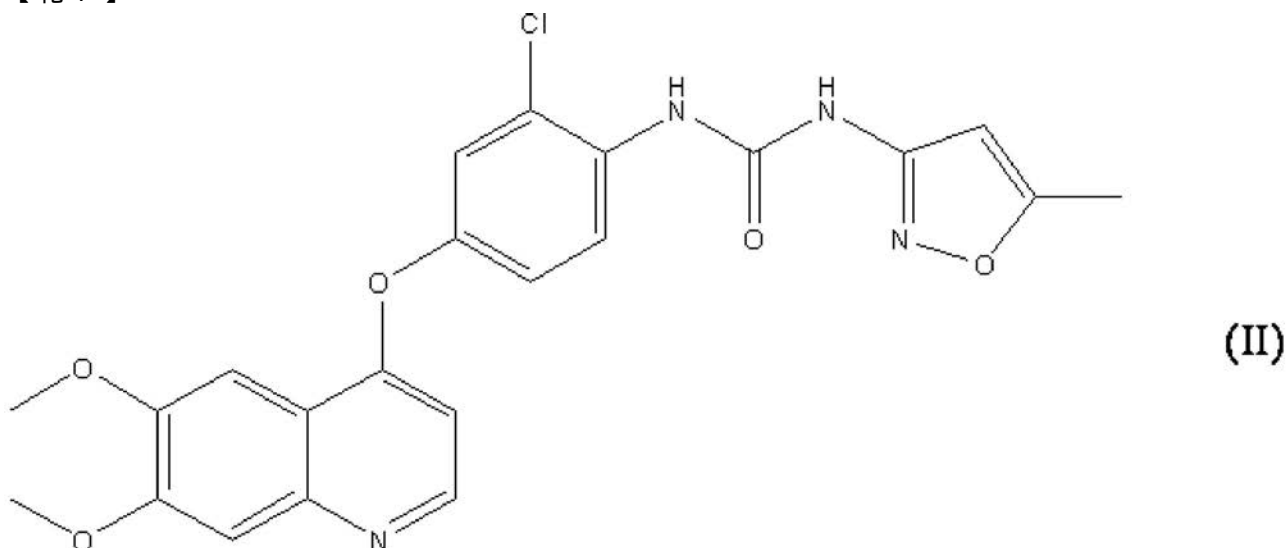
で表される化合物もしくはその薬学的に許容可能な塩、またはそれらの水和物もしくは溶媒和物であり、

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、ヒドロキシアセチルセルロース、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、嚢腫状黄斑浮腫、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。