【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3年9月9日(2021.9.9)

【公表番号】特表2021-511317(P2021-511317A)
【公表日】令和3年5月6日(2021.5.6)
【年通号数】公開・登録公報2021-021
【出願番号】特願2020-539288(P2020-539288)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/454　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/08　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/40　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/36　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　27/14　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/454
Ａ６１Ｋ　 9/08
Ａ６１Ｋ　47/40
Ａ６１Ｋ　47/36
Ａ６１Ｐ　27/14
Ａ６１Ｐ　43/00　１１３

【手続補正書】
【提出日】令和3年7月29日(2021.7.29)
【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】
水性眼科用医薬組成物であって、
ａ）少なくとも０．４ｗ／ｖ％以上１．０ｗ／ｖ％以下のビラスチン、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物であって、該ビラスチンまたはその塩もしくは溶媒和物が前記水性眼科用医薬組成物中に完全に溶解しているもの；
ｂ）未修飾のβ－シクロデキストリン、C_{1}～C_{6}アルキル－β－シクロデキストリン、C_{1}～C_{6}ヒドロキシアルキルβ－シクロデキストリン、C_{1}～C_{6}カルボキシアルキル－β－シクロデキストリン、カルボニル－β－シクロデキストリン、C_{2}～C_{6}スルホアルキルエーテルβ－シクロデキストリンおよびそれらの混合物からなる群から選択される、少なくとも１種のβ－シクロデキストリン；および
ｃ）ヒアルロン酸、ジェランガムおよびそれらの混合物からなる群から選択される、少なくとも１種の薬学的に許容される水溶性ゲル化剤またはその許容される塩
を含有し、前記組成物のｐＨ値が４～９の範囲（該範囲の下限値と上限値の両方が含まれる）である、水性眼科用医薬組成物。
【請求項２】
前記少なくとも１種のβ－シクロデキストリンが、未修飾のβ－シクロデキストリン、C_{1}～C_{6}アルキル－β－シクロデキストリン、ヒドロキシエチル－β－シクロデキストリン、ヒドロキシプロピル－β－シクロデキストリン、２－ヒドロキシブチル－β－シクロデキストリン、C_{1}～C_{6}カルボキシアルキル－β－シクロデキストリン、カルボニル

－β－シクロデキストリン、C_2～C_6スルホアルキルエーテルβ－シクロデキストリンおよびそれらの混合物からなる群から選択される、請求項１に記載の眼科用医薬組成物。

【請求項３】

少なくとも０．６ｗ／ｖ％のビラスチンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含有し、該ビラスチンまたはその塩もしくは溶媒和物が前記水性眼科用医薬組成物中に完全に溶解している、請求項１または２に記載の眼科用医薬組成物。

【請求項４】

請求項１から３のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物であって、

ａ）少なくとも０．６ｗ／ｖ％以上１．０ｗ／ｖ％以下のビラスチンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物であって、該ビラスチンまたは該その塩もしくは溶媒和物が前記水性眼科用医薬組成物中に完全に溶解しているもの；

ｂ）未修飾のβ－シクロデキストリン、C_1～C_6アルキル－β－シクロデキストリン、ヒドロキシエチル－β－シクロデキストリン、ヒドロキシプロピル－β－シクロデキストリン、２－ヒドロキシブチル－β－シクロデキストリン、C_1～C_6カルボキシアルキル－β－シクロデキストリン、カルボニル－β－シクロデキストリン、C_2～C_6スルホアルキルエーテルβ－シクロデキストリンおよびそれらの混合物からなる群から選択される、少なくとも１種のβ－シクロデキストリンであって、該β－シクロデキストリンの濃度が少なくとも５ｗ／ｖ％以上１５ｗ／ｖ％以下であるもの；および

ｃ）ヒアルロン酸またはその薬学的に許容される塩であって、該ヒアルロン酸またはその薬学的に許容される塩の濃度が少なくとも０．０５ｗ／ｖ％以上１ｗ／ｖ％以下であるもの

を含有する、眼科用医薬組成物。

【請求項５】

前記C_1～C_6β－シクロデキストリンが、ヒドロキシエチル－β－シクロデキストリン、ヒドロキシプロピル－β－シクロデキストリンおよび２－ヒドロキシブチル－β－シクロデキストリンからなる群から選択されるヒドロキシアルキルβ－シクロデキストリンである、請求項１または３のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物。

【請求項６】

前記ヒアルロン酸またはその薬学的に許容される塩が６０００００Ｄａ以下の分子量を有する、請求項１から５のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物。

【請求項７】

前記ｐＨが５～８の範囲（該範囲の下限値と上限値の両方が含まれる）である、請求項１から６のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物。

【請求項８】

前記組成物が約２５０ｍＯｓｍ／ｋｇ～約６００ｍＯｓｍ／ｋｇの範囲の浸透圧を有する、請求項１から７のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物。

【請求項９】

グリセリン、ソルビトール、マンニトール、エリスリトール、アラビトール、キシリトール、リビトール、ガラクチトール、マルチトール、マクロゴール、ラクチトール、およびそれらの混合物からなる群から選択される等張化剤をさらに含有する、請求項１から８のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物。

【請求項１０】

請求項１から９のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物であって、

ａ）少なくとも０．６ｗ／ｖ％以上１．０ｗ／ｖ％以下のビラスチンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物であって、該ビラスチンまたは該その塩もしくは溶媒和物が前記水性眼科用医薬組成物中に完全に溶解しているもの；

ｂ）少なくとも１種のC_1～C_6ヒドロキシアルキルβ－シクロデキストリンであって、該β－シクロデキストリンの濃度が少なくとも５ｗ／ｖ％以上１５ｗ／ｖ％以下であるもの；

ｃ）ヒアルロン酸またはその薬学的に許容される塩であって、該ヒアルロン酸またはその

薬学的に許容される塩の濃度が少なくとも０．０５ｗ／ｖ％以上１ｗ／ｖ％以下であるもの；
ｄ）セルロースのエーテル誘導体、ポリエチレングリコール、ポリビニルアルコール、およびそれらの混合物からなる群から選択される、０．００１ｗ／ｖ％～１５ｗ／ｖ％の少なくとも１種の薬学的に許容される水溶性ポリマー；および
ｅ）グリセリン、ソルビトール、マンニトール、エリスリオール、アラビトール、キシリトール、リビトール、ガラクチトール、マルチトール、マクロゴール、ラクチトール、およびそれらの混合物からなる群から選択される、０．０５ｗ／ｖ％～５ｗ／ｖ％の少なくとも１種の等張化剤
を含有する、眼科用医薬組成物。
【請求項１１】
請求項１から１０のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物であって、
ａ）少なくとも０．６ｗ／ｖ％以上１．０ｗ／ｖ％以下のビラスチンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物であって、該ビラスチンまたは該その塩もしくは溶媒和物が前記水性眼科用医薬組成物中に完全に溶解しているもの；
ｂ）少なくとも１種のC_{1}～C_{6}ヒドロキシアルキルβ－シクロデキストリンであって、該β－シクロデキストリンの濃度が少なくとも５ｗ／ｖ％以上１５ｗ／ｖ％以下であるもの；
ｃ）ヒアルロン酸またはその薬学的に許容される塩であって、該ヒアルロン酸またはその薬学的に許容される塩の濃度が少なくとも０．０５ｗ／ｖ％以上１ｗ／ｖ％以下であるもの；
ｄ）０．００１ｗ／ｖ％～１５ｗ／ｖ％のセルロースのエーテル誘導体；および
ｅ）０．０５ｗ／ｖ％～５ｗ／ｖ％のグリセリン
を含有する、眼科用医薬組成物。
【請求項１２】
請求項１から１１のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物であって、
ａ）少なくとも０．６ｗ／ｖ％以上１．０ｗ／ｖ％以下のビラスチンまたはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物であって、該ビラスチンまたは該その塩もしくは溶媒和物が前記水性眼科用医薬組成物中に完全に溶解しているもの；
ｂ）少なくとも１種のC_{1}～C_{6}ヒドロキシアルキルβ－シクロデキストリンであって、該β－シクロデキストリンの濃度が少なくとも５ｗ／ｖ％以上１５ｗ／ｖ％以下であるもの；
ｃ）ヒアルロン酸またはその薬学的に許容される塩であって、該ヒアルロン酸またはその薬学的に許容される塩の濃度が少なくとも０．０５ｗ／ｖ％以上１ｗ／ｖ％以下であるもの；
ｄ）０．００５ｗ／ｖ％～０．１ｗ／ｖ％のメチルセルロース；および
ｅ）０．５ｗ／ｖ％～２ｗ／ｖ％のグリセリン
を含有する、眼科用医薬組成物。
【請求項１３】
１日１回の眼科用医薬組成物であることを特徴とする、請求項１から１２のいずれか一項に記載の眼科用医薬組成物。
【請求項１４】
H_{1}ヒスタミン受容体の拮抗作用によって改善しやすい障害または疾患の治療および／または予防のための、請求項１から１３のいずれか一項に記載の水性眼科用医薬組成物。
【請求項１５】
前記H_{1}ヒスタミン受容体の拮抗作用によって改善しやすい障害または疾患が、眼のアレルギー性障害、アレルギー性疾患またはアレルギー症状である、請求項１４に記載の水性眼科用医薬組成物。
【請求項１６】
前記H_{1}ヒスタミン受容体の拮抗作用によって改善しやすい障害または疾患が、鼻炎、

鼻結膜炎、アレルギー性結膜炎、春季角結膜炎、アトピー性角結膜炎、巨大乳頭結膜炎、眼刺激、掻痒感、発赤、流涙、結膜浮腫、乾性角膜炎、乾性角結膜炎または機能不全涙症候群である、請求項１４または１５のいずれか一項に記載の水性眼科用医薬組成物。