

【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 5 年 3 月 10 日(2023.3.10)

【国際公開番号】WO2020/184479

【出願番号】特願 2021-505049(P2021-505049)

【国際特許分類】

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 P 27/04(2006.01)

A 6 1 P 27/14(2006.01)

A 6 1 P 25/04(2006.01)

A 6 1 K 31/045(2006.01)

A 6 1 K 47/08(2006.01)

A 6 1 K 47/14(2017.01)

A 6 1 K 47/10(2017.01)

A 6 1 K 47/22(2006.01)

A 6 1 K 47/06(2006.01)

C 1 2 Q 1/02(2006.01)

A 6 1 K 31/135(2006.01)

A 6 1 K 31/4164(2006.01)

A 6 1 K 31/4402(2006.01)

10

20

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/04

A 6 1 P 27/14

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/045

A 6 1 K 47/08

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/06

C 1 2 Q 1/02

A 6 1 K 31/135

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 K 31/4402

30

40

【手続補正書】

【提出日】令和 5 年 3 月 1 日(2023.3.1)

【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】

50

【請求項 1】

以下の (A - 3) 成分、(A - 1) 成分、(A - 2) 成分、及び (A - 4) 成分からなる群より選択される少なくとも 1 種を含有することを特徴とする、眼科組成物用の刺激抑制剤：

(A - 3) カンフル、メントン、イソメントール、シネオール、メントフラン、ピネン、リモネン、ネオメントール、及びメチルアセテートからなる群より選択される少なくとも 1 種、

(A - 1) 充血除去成分、

(A - 2) 抗ヒスタミン成分、及び

(A - 4) 局所麻酔成分。

10

【請求項 2】

(B) 1 - メントールを含有する眼科組成物用であり、眼科組成物中に 1 - メントールと共存することで 1 - メントールの刺激感を抑制するための剤であることを特徴とする、請求項 1 に記載の刺激抑制剤。

【請求項 3】

眼科組成物中における (B) 成分に対する (A - 3) 成分の含有比率が、(B) 成分の総含有量 1 重量部に対して、0.000001 ~ 500000 重量部であり、(B) 成分に対する (A - 1) 成分の含有比率が、(B) 成分の総含有量 1 重量部に対して、0.001 ~ 1000 重量部であり、(B) 成分に対する (A - 2) 成分の含有比率が、(B) 成分の総含有量 1 重量部に対して、0.002 ~ 50000 重量部であり、(B) 成分に対する (A - 4) 成分の含有比率が、(B) 成分の総含有量 1 重量部に対して、0.01 ~ 5000 重量部である、請求項 2 に記載の刺激抑制剤。

20

【請求項 4】

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の刺激抑制剤を含有する、眼科組成物。

【請求項 5】

以下の (A - 3) 成分、(A - 1) 成分、(A - 2) 成分、及び (A - 4) 成分からなる群より選択される少なくとも 1 種を含有することを特徴とする、眼科組成物用の、刺激受容体 TRPA1 の活性阻害剤：

(A - 3) カンフル、メントン、イソメントール、シネオール、メントフラン、ピネン、リモネン、ネオメントール、及びメチルアセテートからなる群より選択される少なくとも 1 種、

(A - 1) 充血除去成分、

(A - 2) 抗ヒスタミン成分、及び

(A - 4) 局所麻酔成分。

30

【請求項 6】

(B) 1 - メントールを含有する眼科組成物用であり、眼科組成物中に 1 - メントールと共存することで 1 - メントールによる刺激受容体 TRPA1 の活性を阻害するための剤であることを特徴とする、請求項 5 に記載の TRPA1 の活性阻害剤。

【請求項 7】

眼科組成物中における (B) 成分に対する (A - 3) 成分の含有比率が、(B) 成分の総含有量 1 重量部に対して、0.000001 ~ 500000 重量部であり、(B) 成分に対する (A - 1) 成分の含有比率が、(B) 成分の総含有量 1 重量部に対して、0.001 ~ 1000 重量部であり、(B) 成分に対する (A - 2) 成分の含有比率が、(B) 成分の総含有量 1 重量部に対して、0.002 ~ 50000 重量部であり、(B) 成分に対する (A - 4) 成分の含有比率が、(B) 成分の総含有量 1 重量部に対して、0.01 ~ 5000 重量部である、請求項 5 に記載の TRPA1 の活性阻害剤。

40

【請求項 8】

請求項 5 ~ 7 のいずれか一項に記載の TRPA1 の活性阻害剤を含有する眼科組成物。

【請求項 9】

(B) TRPA1 アゴニストを含有する眼科組成物に、さらに、以下の (A - 3) 成分

50

、(A - 1) 成分、(A - 2) 成分、及び(A - 4) 成分からなる群より選択される少なくとも 1 種を含有させる工程を含むことを特徴とする、(B) T R P A 1 アゴニストに由来する眼科組成物の刺激を抑制する方法：

(A - 3) カンフル、メントン、イソメントール、シネオール、メントフラン、ピネン、リモネン、ネオメントール、及びメチルアセテートからなる群より選択される少なくとも 1 種、

(A - 1) 充血除去成分、

(A - 2) 抗ヒスタミン成分、及び

(A - 4) 局所麻酔成分。

【請求項 1 0】

(B) T R P A 1 アゴニストを含有する眼科組成物に、さらに、以下の(A - 3) 成分、(A - 1) 成分、(A - 2) 成分、及び(A - 4) 成分からなる群より選択される少なくとも 1 種を含有させる工程を含むことを特徴とする、(B) T R P A 1 アゴニストの活性阻害方法：

(A - 3) カンフル、メントン、イソメントール、シネオール、メントフラン、ピネン、リモネン、ネオメントール、及びメチルアセテートからなる群より選択される少なくとも 1 種、

(A - 1) 充血除去成分、

(A - 2) 抗ヒスタミン成分、及び

(A - 4) 局所麻酔成分

【請求項 1 1】

被験試料を、T R P A 1 発現細胞と接触させ、前記被験試料により T R P A 1 を介して引き起こされる細胞内カルシウムイオン濃度の変化量を測定することを特徴とする、被験試料による眼刺激の評価方法。

【請求項 1 2】

以下の(A - 3) 成分、(A - 1) 成分、(A - 2) 成分、及び(A - 4) 成分からなる群より選択される少なくとも 1 種を含有することを特徴とする、ドライアイやアレルギー等に由来する疼痛抑制用の眼科組成物：

(A - 3) カンフル、メントン、イソメントール、シネオール、メントフラン、ピネン、リモネン、ネオメントール、及びメチルアセテートからなる群より選択される少なくとも 1 種、

(A - 1) 充血除去成分、

(A - 2) 抗ヒスタミン成分、及び

(A - 4) 局所麻酔成分。

10

20

30

40

50