

【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 61K 45/00(2006.01)

A 61P 43/00(2006.01)

A 61P 27/02(2006.01)

A 61P 27/04(2006.01)

A 61P 27/14(2006.01)

A 61P 25/04(2006.01)

A 61K 31/045(2006.01)

A 61K 47/08(2006.01)

A 61K 47/14(2017.01)

A 61K 47/10(2017.01)

A 61K 47/22(2006.01)

A 61K 47/06(2006.01)

C 12Q 1/02(2006.01)

A 61K 31/135(2006.01)

A 61K 31/4164(2006.01)

A 61K 31/4402(2006.01)

10

20

30

40

【F I】

A 61K 45/00

A 61P 43/00 1 2 1

A 61P 27/02

A 61P 27/04

A 61P 27/14

A 61P 25/04

A 61P 43/00 1 1 1

A 61K 31/045

A 61K 47/08

A 61K 47/14

A 61K 47/10

A 61K 47/22

A 61K 47/06

C 12Q 1/02

A 61K 31/135

A 61K 31/4164

A 61K 31/4402

【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、0.01~500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、0.01~500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)TRPA1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10】

(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、(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)TRPA1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

10

20

30

【請求項11】
被験試料を、TRPA1発現細胞と接触させ、前記被験試料によりTRPA1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12】

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。

40

50