

【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1月19日(2023.1.19)

【国際公開番号】WO2020/145364

【出願番号】特願2020-565214(P2020-565214)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/47(2006.01)

A 6 1 K 31/407(2006.01)

A 6 1 K 31/137(2006.01)

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 K 9/06(2006.01)

A 6 1 K 31/551(2006.01)

A 6 1 K 31/4439(2006.01)

A 6 1 K 31/403(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/137

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/403

Z N A

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年12月27日(2022.12.27)

【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

30

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

処置を必要とする対象者における網膜疾患を予防もしくは治療する、または疾患の進行を抑制するための、有効量の下記群からなる群から選ばれる少なくとも1つの化合物、および医薬的に許容し得る担体を含む、眼内投与または経口投与用の医薬組成物：

群：メチルドパ（メチルドーパセスキ水和物）、アポモルヒネ（(R)-(-)-アポモルヒネ塩酸）、エセロリン（(-)-エセロリンフマル酸塩）、エトキシキン（6-エトキシ-2,2,4-トリメチル-1,2-ジヒドロキノリン）、オランザピン（2-メチル-4-(4-メチル-1-ピペラジニル)-10H-チエノ[2,3-b][1,5]ベンゾジアゼピン）、3-アミノ-4-(フェニルアミノ)安息香酸メチル、3-アミノ-4-((4-メトキシフェニル)アミノ)安息香酸メチル、3-アミノ-4-((3-メトキシフェニル)アミノ)安息香酸メチル、3-アミノ-4-(ベンジルアミノ)安息香酸メチル、3-アミノ-4-((1-フェニルエチル)アミノ)安息香酸メチル、1-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)インドリン-5-アミン、1-(3,5-ジメチルフェニル)-1H-インドール-6-アミン、1-(3,5-ジメチルフェニル)インドリン-6-アミン、1-(4-メトキシフェニル)-1H-インドール-6-アミン、1-(4-(メチルチオ)フェニル)-1H-インドール-6-アミン、1-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-1H-インドール-5-アミン、およびインダパミド（4-クロロ-N-[(2RS)-2-メチル-2,3

40

50

- ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル ] - 3 - スルファモイルベンズアミドからなる群。

【請求項 2】

該化合物が、下記群から選ばれる少なくとも 1 つの化合物である、請求項 1 記載の医薬組成物：

群：メチルドパ（メチルドーパ セスキ水和物）、アポモルヒネ（(R) - (-) - アポモルヒネ 塩酸）、エセロリン（(-) - エセロリンフマル酸塩）、エトキシキン（6 - エトキシ - 2, 2, 4 - トリメチル - 1, 2 - ジヒドロキノリン）、オランザピン（2 - メチル - 4 - (4 - メチル - 1 - ピペラジニル) - 10 H - チエノ[2, 3 - b][1, 5]ベンゾジアゼピン）、およびインダパミド（4 - クロロ - N - [(2RS) - 2 - メチル - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル] - 3 - スルファモイルベンズアミドからなる群。

10

【請求項 3】

該網膜疾患が、加齢黄斑変性症、糖尿病網膜症、網膜色素変性症、スターガルト症、高血圧性網膜症、緑内障、白内障、網膜中心動脈閉塞症、特発性ポリプ状脈絡膜血管症、レーバー先天性黒内障（LCA）、アッシャー症候群、コロイデレミア、桿体 - 錐体もしくは錐体 - 桿体ジストロフィー、繊毛障害、ミトコンドリア障害、進行性網膜萎縮、地図状萎縮、家族性もしくは後天性黄斑症、網膜光受容体疾患、網膜色素上皮を基礎とする疾患、類嚢胞黄斑浮腫、網膜変性疾患、硝子体混濁、ブドウ膜炎、網膜剥離、外傷性網膜損傷、医原性網膜損傷、黄斑円孔、黄斑部毛細血管拡張症、神経節細胞疾患、視神経細胞疾患、視神経症、虚血性網膜疾患、未熟児網膜症、網膜血管閉塞、家族性細動脈瘤、網膜血管疾患、眼血管疾患、血管疾患、または虚血性視神経症からなる群から選ばれる 1 つ以上の疾患である、請求項 1 または 2 のいずれかに記載の医薬組成物。

20

【請求項 4】

該網膜疾患が、加齢黄斑変性症である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 5】

該加齢黄斑変性症が、萎縮型（ドライ型）の加齢黄斑変性症である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 6】

該加齢黄斑変性症が、滲出型（ウェット型）の加齢黄斑変性疾患である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物。

30

【請求項 7】

点眼剤または眼軟膏剤として製剤化される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 8】

該化合物の有効量が、各化合物の半数致死量の約 10 分の 1 以下の低用量である、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 9】

該化合物の有効量が、眼内投与用医薬組成物の重量あたり約 5 重量% 以下であり、経口投与用医薬組成物の重量あたり約 80 重量% 以下である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物。

40

【請求項 10】

処置を必要とする対象者における網膜疾患を予防もしくは治療する、または疾患の進行を抑制するための、有効量の請求項 1 または 2 に記載の群から選ばれる少なくとも 1 つの化合物、および医薬的に許容し得る担体を含む、点眼剤。

【請求項 11】

処置を必要とする対象者における網膜疾患を予防もしくは治療する、または疾患の進行を抑制するための、有効量の請求項 1 または 2 に記載の群から選ばれる少なくとも 1 つの化合物、および医薬的に許容し得る担体を含む、経口剤。

【請求項 12】

50

処置を必要とする対象者における網膜疾患を予防もしくは治療する、または疾患の進行を抑制するための、眼内投与または経口投与用の医薬の製造における、請求項 1 または 2 に記載の群から選ばれる少なくとも 1 つの化合物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】図面

【補正対象項目名】図 6

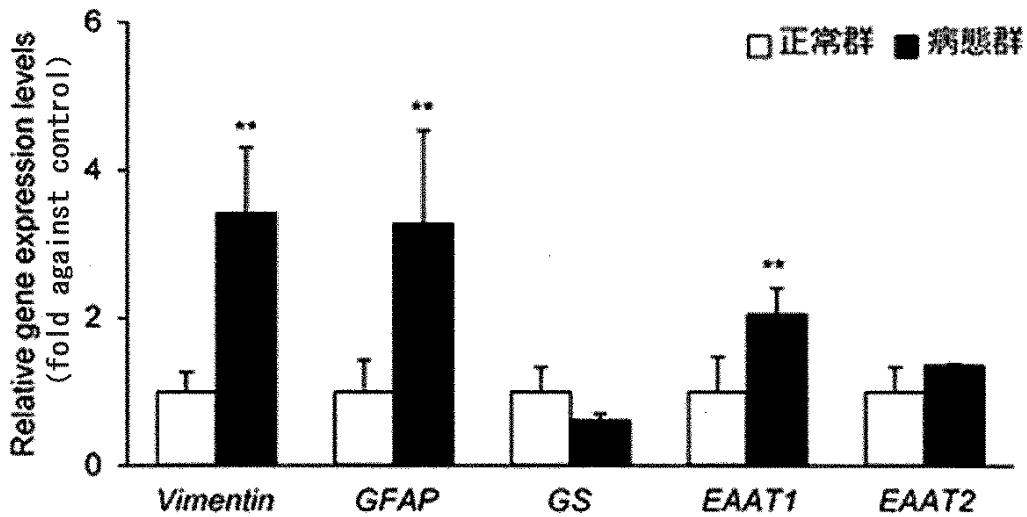
【補正方法】変更

【補正の内容】

【図 6】

10

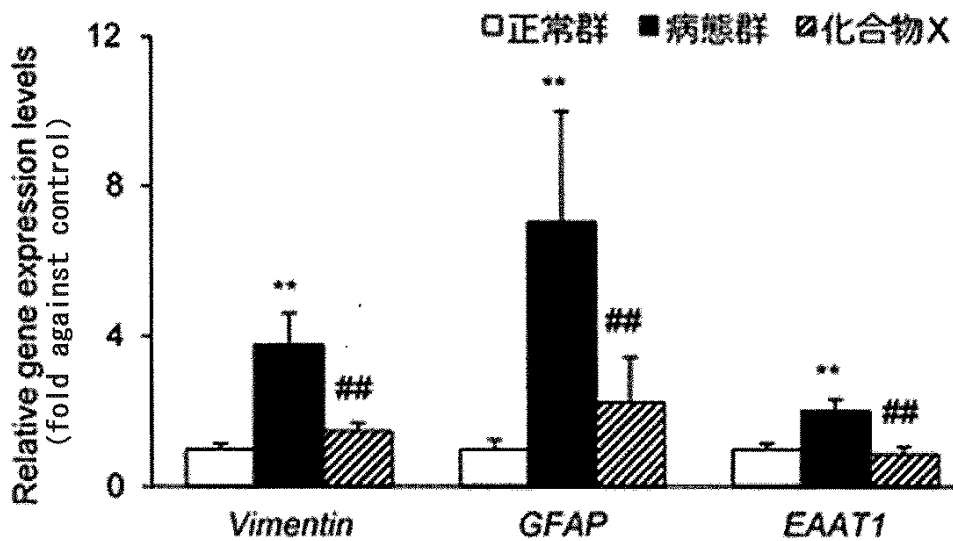
A.



Mean + S.D., (n=4), \*\*p<0.01 v.s. 正常群

20

B.



Mean + S.D., (n=4), \*\*p<0.01 v.s. 正常群, ## p<0.01 v.s. 病態群

30

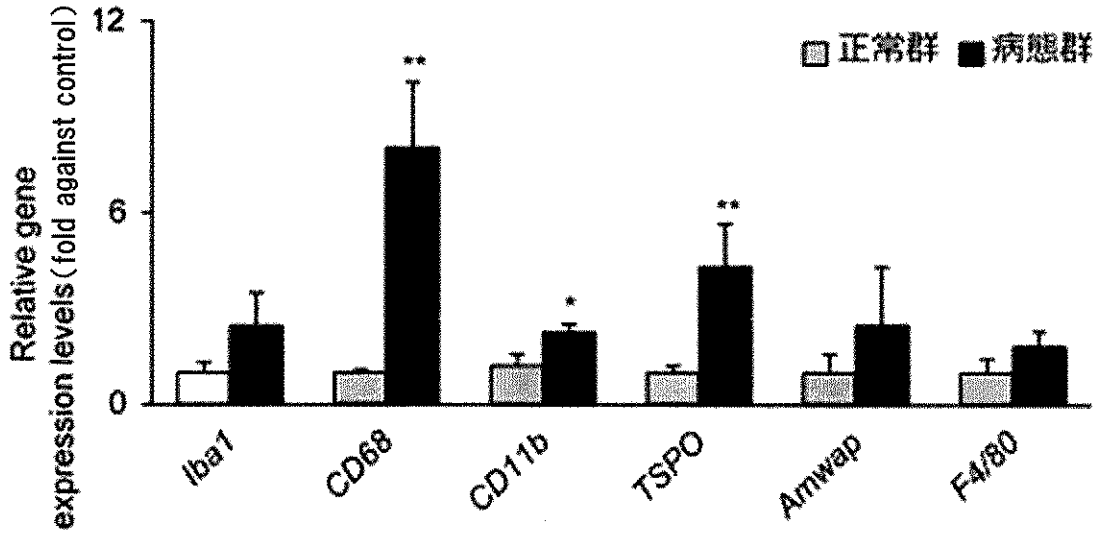
40

【手続補正 3】

50

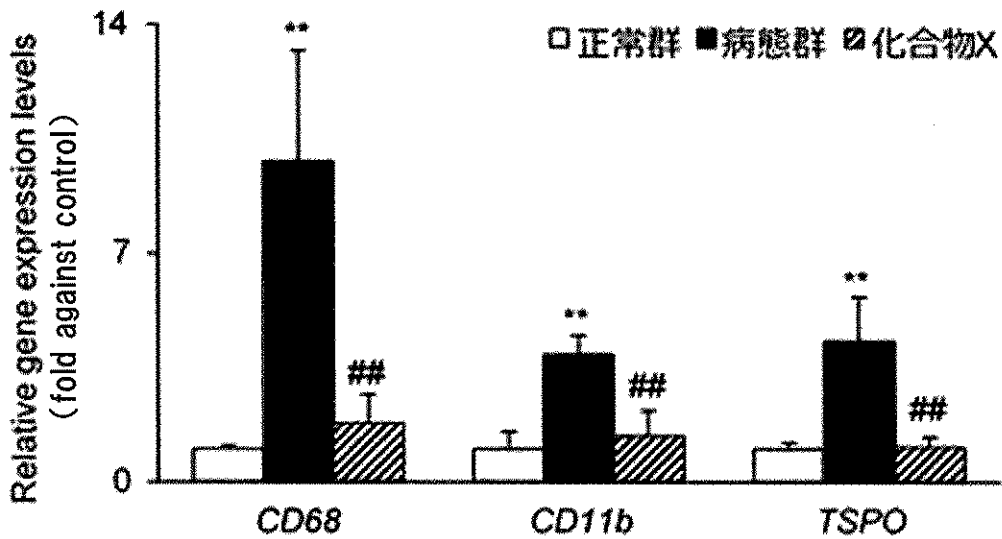
【補正対象書類名】図面  
 【補正対象項目名】図7  
 【補正方法】変更  
 【補正の内容】  
 【図7】

A.



Mean + S.D., (n=4), \*p<0.05, \*\*p<0.01 v.s. 正常群

B.



Mean + S.D., (n=4), \*\*p<0.01 v.s. 正常群, ## p<0.01 v.s. 病態群

【手続補正4】  
 【補正対象書類名】図面  
 【補正対象項目名】図8  
 【補正方法】変更  
 【補正の内容】

10

20

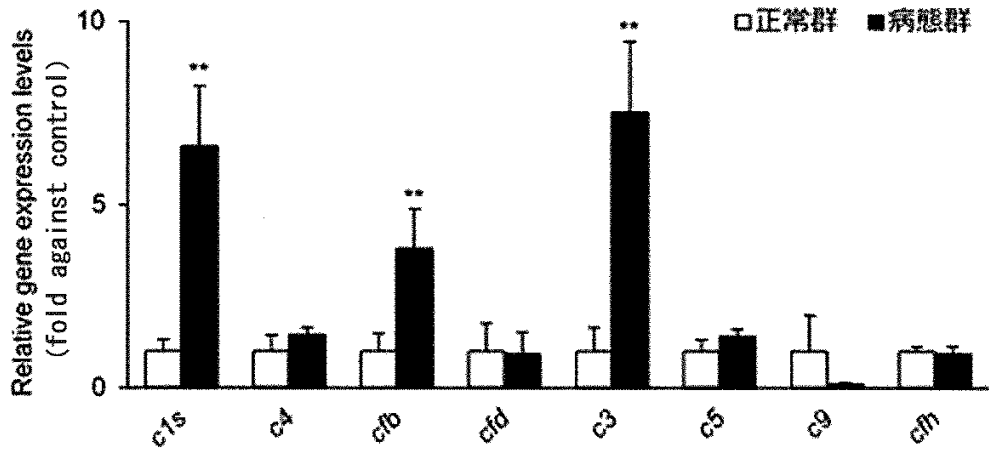
30

40

50

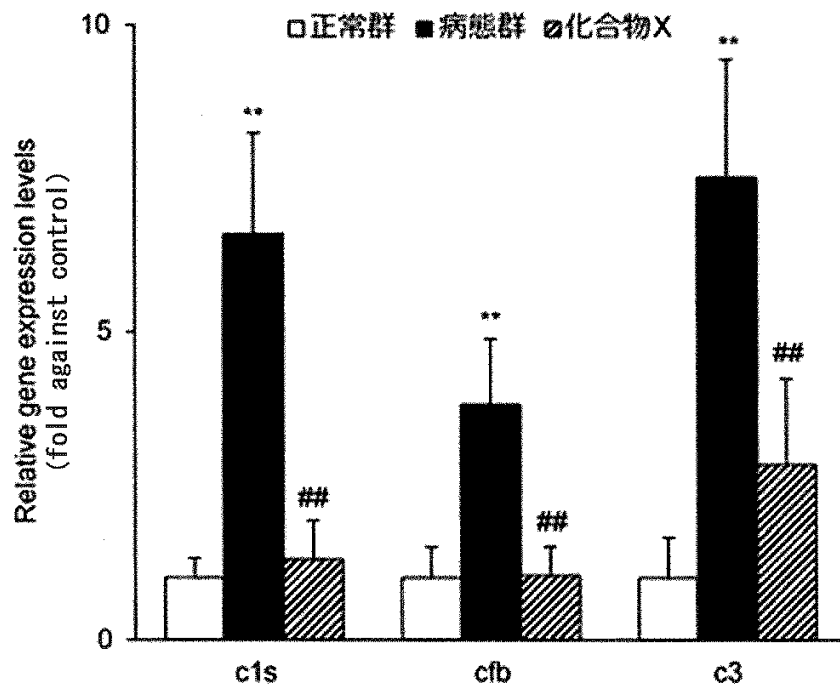
【 図 8 】

A.



Mean + S.D., (n=4), \*\*p<0.01 v.s. 正常群

B.



Mean + S.D., (n=4), \*\*p<0.01 v.s. 正常群, ## p<0.01 v.s. 病態群

10

20

30

40

50