

【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 4 年 8 月 9 日(2022.8.9)

【国際公開番号】WO2020/009248

【出願番号】特願 2020-529077(P2020-529077)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 38/15(2006.01)

A 6 1 P 27/06(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 38/15

A 6 1 P 27/06

【手続補正書】

20

【提出日】令和 4 年 7 月 25 日(2022.7.25)

【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】

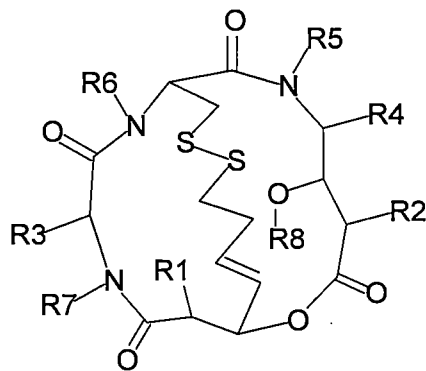
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式 I :

【化 1】

30

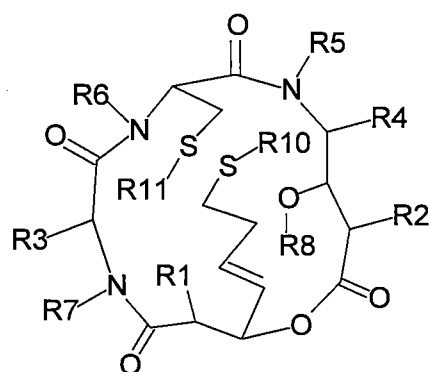


(I)

40

又は次式 II :

## 【化 2】



(II)

10

(式中、R1～R3は独立して水素原子、メチル基又はエチル基、R4は水素原子、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、sec-ブチル基又はイソブチル基、R5～R8はそれぞれ独立して水素原子、メチル基、エチル基又はイソプロピル基、R8は水素原子、メチル基又は保護基、R10及びR11は、独立して水素原子、メチル基又は保護基を表す。)

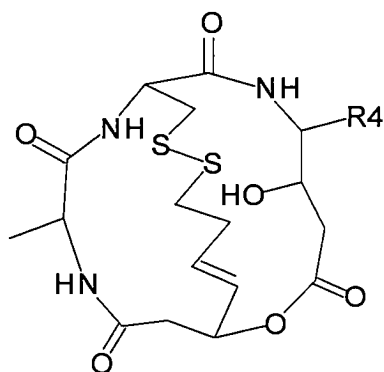
で示されるデシペプチド化合物又はその製薬学的に許容可能な塩を含む、眼組織の線維化抑制用医薬組成物。

20

## 【請求項 2】

式Iで示されるデシペプチド化合物が、次式III：

## 【化 3】



(III)

30

(式中、R4はイソプロピル基、sec-ブチル基又はイソブチル基を表す。)

で示されるものである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3】

R4がイソプロピル基である、請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 4】

40

眼組織の線維化抑制が、眼組織において、線維化、血管新生及び瘢痕形成の 3 段階の各々に係る病態増悪因子遺伝子発現のうち、各段階につき少なくとも 1 種の遺伝子発現を *in vivo* で阻害することによるものである、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 5】

病態増悪因子遺伝子が、collagen 1A、collagen 3A1、collagen 4A1、TIMP 2、TIMP 3、TIMP 4、Thrombospondin 1、Thrombospondin 2、LOX、Lox12、TGFB2、TGFB3、CTGF、VEGF、PDGF及びSerpinからなる群から選ばれる少なくとも 1 種である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 6】

50

眼組織の線維化を $100\text{pg/kg} \sim 3000\text{pg/kg}$ の投与量で抑制する、請求項1～5のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項7】

眼組織の線維化を $2\text{pg/eye} \sim 9000\text{pg/eye}$ の投与量で抑制する、請求項1～5のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項8】

眼組織の線維化抑制が、眼組織培養細胞の線維化様相転移の抑制、及び/又は眼組織細胞のHDAC活性の阻害によるものである、請求項1～7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項9】

眼組織培養細胞の線維化様相転移を $10\text{nM}$ 以下の濃度で抑制する、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項10】

眼組織細胞のHDAC活性を $\text{IC}_{50} = 10\text{nM}$ 以下の濃度で阻害する、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項11】

眼組織の線維化抑制が、濾過胞維持効果、又は緑内障手術の予後向上効果をもたらす、請求項1～10のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項12】

眼組織の線維化抑制が、線維化抑制効果及び/又は血管新生抑制効果と、瘢痕形成抑制効果の両者をもたらす、請求項1～11のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項13】

眼組織が、緑内障関連組織、結膜関連組織及び網膜関連組織からなる群から選ばれる少なくとも1つである、請求項1～12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項14】

緑内障関連組織が、線維柱帯、又は眼圧の制御が可能な組織である請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

網膜関連組織が、網膜色素上皮、脈絡膜新生血管、又は加齢黄斑変性に係る組織である請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項16】

結膜関連組織が、濾過胞組織である請求項13に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50