

【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10月27日(2022.10.27)

【国際公開番号】WO2016/179007

【公表番号】特表2018-514592(P2018-514592A)

【公表日】平成30年6月7日(2018.6.7)

【出願番号】特願2018-508628(P2018-508628)

【国際特許分類】

A 61K 38/08(2019.01)

10

A 61P 27/02(2006.01)

A 61K 45/00(2006.01)

A 61K 38/10(2006.01)

A 61P 43/00(2006.01)

A 61K 31/573(2006.01)

A 61K 9/08(2006.01)

A 61K 9/127(2006.01)

A 61K 9/107(2006.01)

A 61K 9/14(2006.01)

A 61K 9/06(2006.01)

20

A 61K 9/10(2006.01)

A 61K 9/12(2006.01)

A 61P 27/06(2006.01)

C 07K 7/06(2006.01)

C 07K 7/08(2006.01)

【F I】

A 61K 38/08

A 61P 27/02

A 61K 45/00

A 61K 38/10

30

A 61P 43/00 121

A 61K 31/573

A 61K 9/08

A 61K 9/127

A 61K 9/107

A 61K 9/14

A 61K 9/06

A 61K 9/10

A 61K 9/12

A 61P 27/06

40

C 07K 7/06

Z N A

C 07K 7/08

【誤訳訂正書】

【提出日】令和4年10月12日(2022.10.12)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

50

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

(D-Asn-Ile-Pro-Nva-Leu-Tyr-D-Ser-Phe-Ala-D-Ser-His-Pro)₂-Dab-NH₂ (配列番号 7) またはその誘導体である、アディポネクチンペプチド模倣化合物またはその薬学的に許容される塩、および、薬学的に許容される担体を含む組成物であって、
 1) 治療有効量を被験体に投与し、必要とする被験体のドライアイの治療、
 2) 治療有効量を被験体に投与し、被験体のドライアイの少なくとも 1 つの症状または臨床徵候の緩和、
 3) 治療有効量を被験体に投与し、必要とする被験体の炎症に関連する眼疾患の治療、のいずれかのための組成物。

10

【請求項 2】

前記組成物を被験体に、硝子体内注射、結膜下注射、結膜注射、筋肉内注射、皮下注射、静脈注射、眼内注射、または被験者の眼への移植によって、局所的に投与することを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

1) 前記ドライアイが、低降圧、涙液欠乏症、眼球乾燥症、シェーグレン症候群ドライアイ、非シェーグレン症候群ドライアイ、乾性角結膜炎、水涙欠乏ドライアイ (ADDE) 、蒸発性ドライアイ (EDE) 、環境ドライアイ、スティーブンスジョンソン症候群、眼球類天疱瘡、眼瞼閉鎖不全、感覚神経麻痺、アレルギー性結膜炎関連ドライアイ、ポストウィルス結膜炎ドライアイ、白内障手術後ドライアイ、VDT 手術 関連ドライアイ、およびコンタクトレンズ装着ドライアイからなるグループから選択されること、

2) 前記ドライアイの少なくとも 1 つの症状が、発赤、眼脂、過度の涙、を生じさせないこと、乾燥、刺激、かゆみ、痛み、不快感、炎症、疲労、異物感、ぼやけた視界、およびそれらの任意の組み合わせからなるグループから選択されること、

3) 前記ドライアイの少なくとも 1 つの臨床的徵候が、涙液分泌の変化、涙液クリアランスの変化、眼表面の損傷、角膜上皮欠損、角膜上皮欠損の変化、眼の表面細胞の変化、涙液安定性の変化、涙液容量の変化、涙液組成の変化、涙液浸透圧の変化、およびそれらの任意の組み合わせからなるグループから選択されること、

4) 前記炎症または臨床徵候に関連する眼疾患が、ブドウ膜炎、強膜炎、眼科手術後の炎症、角膜移植、角膜創傷治癒、結膜炎、網膜疾患、緑内障、からなるグループから選択されること、

のいずれかを特徴とする、請求項 1 または請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

1) 前記組成物を被験体に、1 日 1 回、1 日 2 回、1 日 3 回またはそれ以上の頻度で投与すること、

2) 一日おきまたはそれ以下に投与すること、

のいずれかを特徴とする、請求項 1 乃至請求項 3 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 5】

前記アディポネクチンペプチド模倣化合物が、最終組成物の約 0.0001% (重量) ~ 約 90% (重量) の量で存在することを特徴とする、請求項 1 乃至請求項 4 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 6】

前記組成物が、溶液、懸濁液、シロップ、液体、ゲル、ヒドロゲル、エマルジョン、リポソーム、エアロゾル、ミスト、フィルム、懸濁液、コンタクトレンズ、眼内挿入物、ナノ粒子、微粒子、徐放性製剤、および眼科用医療装置に適した製剤からなるグループから選択される製剤中に存在することを特徴とする、請求項 1 乃至請求項 5 のいずれか 1 つに記載の組成物。

【請求項 7】

前記アディポネクチンペプチド模倣化合物が ADP399、または、その薬学的に許容される塩であることを特徴とする、請求項 1 乃至請求項 6 のいずれか 1 つに記載の組成物。

20

30

40

50

【請求項 8】

前記組成物が、2つ以上の異なるアディポネクチンペプチド模倣化合物、または、その薬学的に許容される塩をさらに含むことを特徴とする、請求項1乃至7のいずれか1つに記載の眼科用組成物。

【請求項 9】

(D-Asn-Ile-Pro-Nva-Leu-Tyr-D-Ser-Phe-Ala-D-Ser-His-Pro)₂-Dab-NH₂
(配列番号7)またはその誘導体である、アディポネクチンペプチド模倣化合物またはその薬学的に許容される塩、および、薬学的に許容される担体を含む眼科用組成物。

【請求項 10】

前記アディポネクチンペプチド模倣化合物がADP399、または、その薬学的に許容される塩であることを特徴とする、請求項9に記載の組成物。 10

【請求項 11】

眼科用組成物は、2つ以上の異なるアディポネクチンペプチド模倣化合物またはその薬学的に許容される塩を含むことを特徴とする、請求項9または請求項10に記載の組成物。 20

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0017

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0017】

別の態様では、それを必要とする対象におけるドライアイの少なくとも1つの症状または臨床徴候を緩和するための方法が、本明細書で提供される。該方法は、アディポネクチンペプチド模倣化合物またはその薬学的に許容される塩を含む組成物の治療有効量を被験体に投与することを含み、被験体におけるドライアイの少なくとも1つの症状または臨床徴候を緩和するための薬学的に許容される担体を含む。いくつかの実施形態において、組成物は、2つ以上の異なる、例えば、2、3、4、5、6、7、8、9、10またはそれ以上の異なるアディポネクチンペプチド模倣化合物またはその薬学的に許容される塩を含む。いくつかの実施形態では、ドライアイの少なくとも1つの症状は、発赤、眼脂、過度の涙を生じさせないこと、乾燥、刺激、かゆみ、痛み、不快感、炎症、疲労、異物感、ぼやけた視界、およびそれらの任意の組み合わせを含む。いくつかの実施形態では、ドライアイの少なくとも1つの臨床徴候は、涙液分泌の変化、涙液クリアランスの変化、涙液浸透圧の変化、眼表面損傷、角膜上皮欠損、眼表面の変化出血量の変化、涙液組成の変化、杯細胞またはマイボーム腺または涙腺の生理の変化、外見、数または機能、およびそれらの任意の組み合わせを含むが、これらに限定されない。 30

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0048

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0048】

ペプチド鎖を含む化合物に適用される用語「誘導体」は、ペプチドの側鎖の1つまたは複数のアミノ基、ヒドロキシル基、もしくはカルボキシル基、または、末端のアミノ基もしくはカルボキシル基が、誘導体官能基に修飾されている化合物を意味する。アミノ基の誘導体は、アミド（例、アルキルカルボキサミド、アセトアミドなど）、カルバミン酸（例、アルキルカルバミン酸、カルバミン酸メチルまたはカルバミン酸t-ブチル）、または尿素として用いることができる。ヒドロキシル基（水酸基）はエステル（例、アルカノエート、アセテート、プロピオン酸、またはアレンカルボン酸、安息香酸など）、カルバミン酸（例、アルキルカーボネート、カルバミン酸メチルなど）、炭酸塩（例、アルキルカーボネート、エチルカーボネートなど）として誘導体化することができる。カルボキ 40

50

シル基は、エステル（例、アルキルエステルやエチルエステルなど）またはアミド（例、一次カルボキサミド、N-アルキル二次カルボキサミド、または、-ジアルキルカルボキサミド）として誘導体化することができる。当業者は、誘導体基の取り込みがペプチド特性を変化させないか、または誘導体化基がインビボで（例えば、代謝を介して）除去されるかで、本発明のペプチドの誘導体は親ペプチドの特性保持をもたらすと予想されることを正しく理解することができる。本発明の好ましい実施形態は、3つ以下のアミノ、カルボキシル、およびヒドロキシル基、できれば2つ以下、あるいは1つまたは無の官能基誘導体に修飾されたものである。用語「誘導体」が塩または、誘導体の塩も含む。

10

20

30

40

50