

【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】平成 24 年 4 月 5 日 (2012.4.5)

【公表番号】特表 2011-511789 (P2011-511789A)

【公表日】平成 23 年 4 月 14 日 (2011.4.14)

【年通号数】公開・登録公報 2011-015

【出願番号】特願 2010-545893 (P2010-545893)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/232 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/232

A 6 1 P 27/02

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 2 月 9 日 (2012.2.9)

【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】

対象へ少なくとも 3 か月間投与することによって、前記対象における加齢関連性網膜機能不全を治療又は予防するための組成物であって、医薬として有効な量の合成レチナール誘導体を含む、前記組成物。

【請求項 2】

哺乳動物対象へ少なくとも 3 か月間投与することによって、前記対象におけるロドプシンの再生比率を改善するための組成物であって、医薬として有効な量の合成レチナール誘導体を含む、前記組成物。

【請求項 3】

前記対象へ、少なくとも 6 か月間投与されるか；約 2 週間に 1 回～約 6 週間に 1 回、少なくとも 6 か月間投与されるか；又は約 1 か月に 1 回、約 6 か月～約 10 か月間投与される、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記合成レチナール誘導体が、国際特許出願 PCT/US2005/021812 号（国際公開第 2006/002097 号）に開示された、式 I～XVI のいずれか一つの化合物である、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 5】

(a) 前記合成レチナール誘導体が、9 - シス - レチニルエステル、及び / 又は 11 - シス - レチニルエステルであり；そして

(b) 前記合成レチナール誘導体のエステル置換基が、 $C_1 - C_{10}$  モノカルボン酸、又は  $C_2 - C_{22}$  ポリカルボン酸のカルボキシレート基を含む、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記エステル置換基が、 $C_3 - C_{10}$  のポリカルボン酸のカルボキシレート基を含む、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記合成レチナール誘導体が：9 - シス - 酢酸レチニル、9 - シス - コハク酸レチニル

、 9 - シス - クエン酸レチニル、 9 - シス - ケトグルタル酸レチニル、 9 - シス - フマル酸レチニル、 9 - シス - リンゴ酸レチニル、 及び 9 - シス - オキサロ酢酸レチニルから成る群から選択される、請求項5に記載の組成物。

【請求項 8】

前記合成レチナール誘導体が 9 - シス - 酢酸レチニルである、請求項7に記載の組成物。

【請求項 9】

前記合成レチナール誘導体が： 1 1 - シス - 酢酸レチニル、 1 1 - シス - コハク酸レチニル、 1 1 - シス - クエン酸レチニル、 1 1 - シス - ケトグルタル酸レチニル、 1 1 - シス - フマル酸レチニル、 1 1 - シス - リンゴ酸レチニル、 及び 1 1 - シス - オキサロ酢酸レチニルから成る群から選択される、請求項5に記載の組成物。

【請求項 10】

前記合成レチナール誘導体が 1 1 - シス - 酢酸レチニルである、請求項9に記載の組成物。

【請求項 11】

前記加齢関連性網膜機能不全が、 1 つ以上の以下の臨床症状：光への曝露後における、桿体媒介性暗順応の機能障害、暗視における機能障害、対比感度における機能障害、及び加齢関連性黄斑変性（AMD）によって明示されるか；又は、前記対象がヒトである、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 12】

強制給餌で投与される、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 13】

約 0 . 0 1 ~ 約 1 0 m g / k g 体重の用量で投与される、請求項1 2に記載の組成物。

【請求項 14】

経口投与用に製剤化される、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記対象の眼への投与用に製剤化される、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 16】

点眼剤、眼球内注射可能な溶液、又は眼周囲注射可能な溶液として製剤化される、請求項1 5に記載の組成物。

【請求項 17】

前記合成レチナール誘導体が、国際特許出願 P C T / U S 2 0 0 4 / 0 0 7 9 3 7 号（国際公開第 2 0 0 4 / 0 8 2 6 2 2 号）に開示された、式 I ~ X I I のいずれか一つの化合物である、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 18】

1 日に 1 回未満投与され、そして 1 回あたりの投与量が有効 1 日投与量よりも多いか；  
或いは、  
約 1 日に 1 回、若しくは 1 日おきに 1 回；約 1 週間に 4 回、1 週間に 3 回、若しくは 1 週間に 2 回；又は約 2、3、4、5、6、7、8、若しくは 9 週間ごとに 1 回投与される、  
請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 19】

前記加齢関連性網膜機能不全が進行性である、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。