

【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 1 年 6 月 13 日 (2019.6.13)

【公表番号】特表 2018-514592 (P2018-514592A)

【公表日】平成 30 年 6 月 7 日 (2018.6.7)

【年通号数】公開・登録公報 2018-021

【出願番号】特願 2018-508628 (P2018-508628)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/08 (2019.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

C 0 7 K 7/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 38/08

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 38/10

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/12

A 6 1 P 27/06

C 0 7 K 7/06 Z N A

C 0 7 K 7/08

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 5 月 7 日 (2019.5.7)

【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】**

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と、薬学的に許容される担体とを含む、被験者のドライアイを治療するための治療的有効量の組成物。

【請求項 2】

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 に記載の組成物。

【請求項 3】

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 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記組成物にシクロスポリン、人工涙、コルチコステロイド、抗炎症剤、またはそれらの任意の組み合わせを含むことを特徴とする、請求項 3 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、式 I で表される化合物、または、化 I で示された化合物の誘導体、または化 I で示された化合物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 に記載の組成物。

X-M₁-配列番号 1-M₂-Z (I)、

配列番号 1 が、Xaa₁-Ile-Pro-Xaa₂-Leu-Tyr-Xaa₃-Phe-Ala-Xaa₄-Xaa₅であり、
ここで、

Xaa₁が、Asnまたは非天然アミノ酸であり、

Xaa₂が、Glyまたは非天然アミノ酸であり、

Xaa₃が、Tyrまたは非天然アミノ酸であり、

Xaa₄が、Tyrまたは非天然アミノ酸であり、

Xaa₅が、アミノ酸でなく、-Alaまたは-Ala-NH₂であり、

Xaa₁、Xaa₂、Xaa₃またはXaa₄の少なくとも 1 つが非天然アミノ酸であり、

Xは、必要に応じて1～10個のアミノ酸ペプチド、ポリマー分子、親油性化合物またはペプチド導入ドメインであり、

Zは、必要に応じて1～10個のアミノ酸ペプチド、ポリマー分子、親油性化合物またはペプチド導入ドメインであり、

M₁は、必要に応じて単結合または連結基であり、

M₂は、必要に応じて単結合または連結基であり、

ここで、式 I の化合物がC末端アミノ酸を含む場合、前記C末端アミノ酸が必要に応じてアミド化されている。

【請求項 6】

Xaa₁がD-Asnであり、Xaa₄がD-Serであることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

Xaa₂がノルバリン(Nva)であることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 8】

Xaa₃がD-Serであることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 9】

Xaa₂がNvaであり、Xaa₃がD-Serであることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 10】

Xaa₁がD-Asnであり、Xaa₂はNvaであり、Xaa₃はD-Serであり、Xaa₄がD-Serであることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 11】

Xaa₅が-Alaまたは-Ala-NH₂であることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

前記アディポネクチンペプチド模倣化合物が式 I I で表される化合物、または、その変異、その誘導体、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 に記載の組成物。

$\text{Xaa}_1\text{-Ile-Pro-Xaa}_2\text{-Leu-Tyr-Xaa}_3\text{-Phe-Ala-Xaa}_4$ (配列番号 2) (I I)

ここで、C末端アミノ酸が必要に応じてアミド化されている。

【請求項 1 3】

前記アディポネクチンペプチド模倣化合物が、D-Asn-Ile-Pro-Nva-Leu-Tyr-D-Ser-Phe-Ala-D-Ser (配列番号 3)、D-Asn-Ile-Pro-Nva-Leu-Tyr-D-Ser-Phe-Ala-D-Ser- -Ala (配列番号 4)、D-Asn-Ile-Pro-Nva-Leu-Tyr-D-Ser-Phe-Ala-D-Ser- -Ala-NH₂ (配列番号 5)、D-Asn-Ile-Pro-Nva-Leu-Tyr-D-Ser-Phe-Ala-D-Ser-NH₂ (配列番号 6)、(D-Asn-Ile-Pro-Nva-Leu-Tyr-D-Ser-Phe-Ala-D-Ser-His-Pro)₂-Dab-NH₂ (配列番号 7)、その誘導体、およびその薬学的に許容される塩からなるグループから選択されることを特徴とする、請求項 1 2 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

前記アディポネクチンペプチド模倣化合物が、ADP355と、ADP399と、その薬学的に許容される塩とのいずれであることを特徴とする、請求項 1 3 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

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 9 に記載の組成物。

【請求項 1 6】

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 2 に記載の組成物。

【請求項 1 7】

被験体のドライアイの少なくとも1つの臨床徴候の症状を緩和するため、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と、薬学的に許容される担体とを含む治療的有効量の組成物。

【請求項 1 8】

被験体のドライアイの少なくとも1つの炎症に関連する眼疾患を治療するため、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と、薬学的に許容される担体とを含む治療的有効量の組成物。

【請求項 1 9】

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で提供することを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。