

【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20年4月17日 (2008.4.17)

【公表番号】特表2007-526330(P2007-526330A)

【公表日】平成19年9月13日 (2007.9.13)

【年通号数】公開・登録公報2007-035

【出願番号】特願2007-501982(P2007-501982)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/08 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/7088 (2006.01)

A 6 1 K 8/64 (2006.01)

A 6 1 K 38/28 (2006.01)

A 6 1 K 49/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/18

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 17/00 1 0 1

A 6 1 K 39/00 G

A 6 1 K 39/08

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 31/10

A 6 1 K 31/7088

A 6 1 K 8/64

A 6 1 K 37/26

A 6 1 K 49/00 C

【手続補正書】

【提出日】平成20年2月29日 (2008.2.29)

【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】

治療的に血中グルコースレベルを変えない生物学的に活性なタンパク質と、正に帯電した分枝基を結合した正に帯電した主鎖を含み、経皮送達に有効な量で存在する担体とを含む組成物であって、担体と生物学的に活性なタンパク質との結合が非共有結合性である組成物。

## 【請求項 2】

担体が無い場合の作用物質に比べて、生物学的に活性なタンパク質のより多くの経皮送達を実現する、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 3】

生物学的に活性なタンパク質が治療活性を有する、請求項 2 に記載の組成物。

## 【請求項 4】

治療用タンパク質が少なくとも 50,000 kD の分子量を有する、請求項 3 に記載の組成物。

## 【請求項 5】

主鎖が、正に帯電したポリペプチドを含む、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 6】

主鎖が、約 10,000 ~ 約 1,500,000 の分子量を有する正に帯電したポリペプチドを含む、請求項 5 に記載の組成物。

## 【請求項 7】

主鎖が、約 25,000 ~ 約 1,200,000 の分子量を有する正に帯電したポリペプチドを含む、請求項 5 に記載の組成物。

## 【請求項 8】

主鎖が、約 100,000 ~ 約 1,000,000 の分子量を有する正に帯電したポリペプチドを含む、請求項 5 に記載の組成物。

## 【請求項 9】

主鎖が、正に帯電したポリリジンを含む、請求項 5 に記載の組成物。

## 【請求項 10】

主鎖が、約 10,000 ~ 約 1,500,000 の分子量を有する正に帯電したポリリジンを含む、請求項 9 に記載の組成物。

## 【請求項 11】

主鎖が、約 25,000 ~ 約 1,200,000 の分子量を有する正に帯電したポリリジンを含む、請求項 9 に記載の組成物。

## 【請求項 12】

主鎖が、約 100,000 ~ 約 1,000,000 の分子量を有する正に帯電したポリリジンを含む、請求項 9 に記載の組成物。

## 【請求項 13】

担体が、 $-(gly)_{n_1}-(arg)_{n_2}$ 、HIV-TAT 及びその断片、並びにアンテナペディア PTD 及びその断片若しくは混合物（式中、下付き文字  $n_1$  は、0 ~ 約 20 の整数であり、下付き文字  $n_2$  は、独立に、約 5 ~ 約 25 の奇数である）から独立に選択される正に帯電した分枝基を結合した正に帯電したポリマーを含む、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 14】

正に帯電した分枝基が、式  $-(gly)_{n_1}-(arg)_{n_2}$  を有する基から独立に選択される、請求項 13 に記載の組成物。

## 【請求項 15】

下付き文字  $n_1$  が、約 1 ~ 約 8 の整数である、請求項 14 に記載の組成物。

## 【請求項 16】

下付き文字  $n_1$  が、約 2 ~ 約 5 の整数である、請求項 14 に記載の組成物。

## 【請求項 17】

下付き文字  $n_2$  が、約 7 ~ 約 17 の奇数である、請求項 14 に記載の組成物。

## 【請求項 18】

下付き文字  $n_2$  が、約 7 ~ 約 13 の奇数である、請求項 14 に記載の組成物。

## 【請求項 19】

分枝基が、HIV-TAT 及びその断片から選択される、請求項 13 に記載の組成物。

## 【請求項 20】

結合された正に帯電した分枝基が、式  $(gly)_p - RGRDDRRQRRR - (gly)_q$ 、 $(gly)_p - YGRKKRRQRRR - (gly)_q$ 、又は  $(gly)_p - RKKRRQRRR - (gly)_q$  (式中、下付き文字  $p$  及び  $q$  は、それぞれ独立に、 $0 \sim 20$  の整数である) を有する HIV-TAT 断片である、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

分枝基が、アンテナペディア PTD 基又はその断片である、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 22】

正に帯電したポリマーがポリペプチドを含む、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 23】

ポリペプチドが、ポリリジン、ポリアルギニン、及びポリオルニチンから選択される、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 24】

ポリペプチドがポリリジンである、請求項 23 に記載の組成物。

【請求項 25】

生物学的に活性なタンパク質がボツリヌストキシンである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 26】

ボツリヌストキシンが、ボツリヌストキシンの血清型 A、B、C、D、E、F、及び G から選択される、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 27】

ボツリヌストキシンがボツリヌストキシン誘導体を含む、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 28】

ボツリヌストキシンが組換え型ボツリヌストキシンを含む、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 29】

生物学的に活性な作用物質を送達するための器具と、正に帯電した分枝基を結合した正に帯電した主鎖を含み、経皮送達に有効な量で存在する担体とを含む、請求項 1 に記載の組成物を被験者に投与するためのキット。

【請求項 30】

生物学的に活性な作用物質がボツリヌストキシンである、請求項 29 に記載のキット。

【請求項 31】

組成物が、生物学的に活性なタンパク質を皮膚又は上皮を介して被験者に投与するための器具に含まれる、請求項 29 に記載のキット。

【請求項 32】

器具が皮膚パッチである、請求項 31 に記載のキット。

【請求項 33】

生物学的に活性なタンパク質を皮膚又は上皮に送達するための器具と、 $-(gly)_{n1} - (arg)_{n2}$ 、HIV-TAT 及びその断片、並びにアンテナペディア PTD 及びその断片若しくは混合物 (式中、下付き文字  $n1$  は、 $0 \sim$  約  $20$  の整数であり、下付き文字  $n2$  は、独立に、約  $5 \sim$  約  $25$  の奇数である) から独立に選択される、正に帯電した分枝基を結合した正に帯電した担体を含む組成物とを含む、生物学的に活性なタンパク質を被験者に投与するためのキットであって、担体と生物学的に活性なタンパク質との結合は非共有結合性であるキット。

【請求項 34】

器具が皮膚パッチである、請求項 33 に記載のキット。