【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25年7月18日(2013.7.18)

【公表番号】特表2012-528891(P2012-528891A)
【公表日】平成24年11月15日(2012.11.15)
【年通号数】公開・登録公報2012-048
【出願番号】特願2012-514183(P2012-514183)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｋ　14/00　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　7/06　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　7/08　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　9/08　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　9/12　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　29/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　27/16　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/14　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/12　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　17/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　19/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　21/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　17/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　17/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　11/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　37/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　37/08　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｋ　14/00　ＺＮＡ
Ｃ０７Ｋ　7/06
Ｃ０７Ｋ　7/08
Ａ６１Ｋ　37/02
Ａ６１Ｋ　9/08
Ａ６１Ｋ　9/12
Ａ６１Ｐ　43/00　１０５
Ａ６１Ｐ　29/00
Ａ６１Ｐ　27/16
Ａ６１Ｐ　25/04
Ａ６１Ｐ　1/14
Ａ６１Ｐ　1/10
Ａ６１Ｐ　1/12
Ａ６１Ｐ　1/12　１７１
Ａ６１Ｐ　17/00
Ａ６１Ｐ　19/02
Ａ６１Ｐ　21/00
Ａ６１Ｐ　25/00　１０１

Ａ６１Ｐ　29/00　　１０１
Ａ６１Ｐ　17/04
Ａ６１Ｐ　17/06
Ａ６１Ｐ　11/02
Ａ６１Ｐ　37/02
Ａ６１Ｐ　37/08

【手続補正書】
【提出日】平成25年5月29日(2013.5.29)
【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】
Ｃ末端に伝達配列を含むペプチドであって、該ペプチドは、配列番号３１９、配列番号３２７、配列番号３３７、配列番号３５２、配列番号３５３、配列番号３６７、または配列番号３６８を含む、ペプチド。
【請求項２】
前記伝達配列が、ポリアルギニン配列である、請求項１に記載のペプチド。
【請求項３】
前記伝達配列が、連続した９個のアルギニン残基を含む、請求項１および２のいずれか一項に記載のペプチド。
【請求項４】
前記ペプチドの少なくとも１つのアミノ酸残基が、Ｄ－アミノ酸残基である、請求項１～３のいずれか１項に記載のペプチド。
【請求項５】
配列番号１３３である、請求項１に記載のペプチド。
【請求項６】
配列番号１４１である、請求項１に記載のペプチド。
【請求項７】
配列番号１５１である、請求項１に記載のペプチド。
【請求項８】
配列番号１６６である、請求項１に記載のペプチド。
【請求項９】
配列番号１６７である、請求項１に記載のペプチド。
【請求項１０】
配列番号１８１である、請求項１に記載のペプチド。
【請求項１１】
配列番号１８２である、請求項１に記載のペプチド。
【請求項１２】
配列番号３１９、配列番号３２７、配列番号３３７、配列番号３５２、配列番号３５３、配列番号３６７、または配列番号３６８である、ペプチド。
【請求項１３】
配列番号１～３６８のうちのいずれか一つである、ペプチド。
【請求項１４】
請求項１～１３のいずれか１項に記載のペプチド、および薬学的に受容可能な賦形剤を含む、単位剤形の薬学的組成物。
【請求項１５】

前記薬学的組成物が、軟膏、クリーム、液体、ゲル、膏薬、滴剤、エアロゾル、蒸気、スプレーまたは噴霧の形態である、請求項１４に記載の薬学的組成物。
【請求項１６】
動物における炎症を処置するための組成物であって、請求項１～１３のいずれか１項に記載のペプチドを含む、組成物。
【請求項１７】
前記炎症が、耳の炎症である、請求項１６に記載の組成物。
【請求項１８】
前記炎症が、中耳炎である、請求項１６に記載の組成物。
【請求項１９】
前記動物が、ヒトである、請求項１６～１８のいずれか１項に記載の組成物。
【請求項２０】
前記動物が聴力損失を有し、前記医薬の投与の際に、該聴力が普通のレベルと変わらないレベルまで改善する、請求項１６～１９のいずれか１項に記載の組成物。
【請求項２１】
細胞活性を制御するための組成物であって、請求項１～１３のいずれか１項に記載のペプチドを含む、組成物。
【請求項２２】
前記細胞活性が、ｔｏｌｌ様レセプターによって媒介される、請求項２１に記載の組成物。
【請求項２３】
前記ｔｏｌｌ様レセプターによって媒介される前記細胞活性が、ＴＮＦ－αの分泌である、請求項２２に記載の組成物。
【請求項２４】
局所適用のために製剤化されるものである、請求項１６～２３のいずれか１項に記載の組成物。
【請求項２５】
前記局所適用が、皮膚、毛、外耳、鼓膜、頬腔、鼻腔または舌下腔への適用を含む、請求項２４に記載の組成物。

【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００１８
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００１８】
いくつかの実施形態において、本発明は、中耳および／または内耳の炎症を処置するための医薬の製造におけるペプチドの使用を企図し、ここで、その医薬は、処置を必要とするかまたは欲している動物の鼓膜への投与に適しており、そのペプチドは：
ａ）配列番号１８７～３６９のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含み、ここで、そのペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む。
本発明は、例えば以下の項目を提供する。
（項目１）
ａ）配列番号１８７～３６８のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含むペプチドを含む、薬学的組成物。
（項目２）
前記ペプチドが、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、項目１に記載の薬学的組成物。

（項目３）
前記伝達配列が、ポリアルギニン配列である、項目２に記載の薬学的組成物。
（項目４）
前記伝達配列が、連続した９個のアルギニン残基を含む、項目２または３に記載の薬学的組成物。
（項目５）
前記伝達配列が、連続した９個のアルギニン残基からなる、項目２または３に記載の薬学的組成物。
（項目６）
前記ペプチドが、少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含む、Ｐ１３の誘導体を含む、項目２～５のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目７）
前記ペプチドのアミノ酸残基のすべてが、Ｄ－アミノ酸残基である、項目１～６のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目８）
前記伝達配列の一部でないアミノ酸残基のすべてが、Ｄ－アミノ酸残基である、項目２～６のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目９）
前記伝達配列の少なくとも１つのアミノ酸残基が、Ｄ－アミノ酸残基である、項目２～６のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目１０）
前記伝達配列のアミノ酸残基のすべてが、Ｄ－アミノ酸残基である、項目２～６のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目１１）
前記ペプチドが、配列番号４２～４４、６８～７７、７９～８１、８３、１０２～１０６、１３３、１４１、１５１、１６６、１６７、１８１および１８２のうちのいずれか１つである、項目２～５のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目１２）
前記ペプチドが、配列番号２２８～２３０、２５４～２６３、２６５～２６７、２６９、２８８～２９２、３１９、３２７、３３７、３５２、３５３、３６７および３６８のうちのいずれか１つである、項目１に記載の薬学的組成物。
（項目１３）
薬学的に許容され得る賦形剤をさらに含む、項目１～１２のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目１４）
前記薬学的組成物が、滴剤の形態である、項目１～１３のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目１５）
前記薬学的組成物が、エアロゾル、蒸気、スプレーまたは噴霧の形態である、項目１～１４のいずれか１項に記載の薬学的組成物。
（項目１６）
配列番号１～１８６のうちのいずれか１つの配列を含むペプチドを含む、薬学的組成物。
（項目１７）
配列番号１～３６８のうちのいずれか１つの配列を含む、ペプチド。
（項目１８）
配列番号４２～４４、６８～７７、７９～８１、８３、１０２～１０６、１３３、１４１、１５１、１６６、１６７、１８１、１８２、２２８～２３０、２５４～２６３、２６５～２６７、２６９、２８８～２９２、３１９、３２７、３３７、３５２、３５３、３６７および３６８のうちのいずれか１つの配列を含む、項目１７に記載のペプチド。
（項目１９）

配列番号１～３６９のうちのいずれか１つの配列を含むペプチドの誘導体であって、ここで、該誘導体は、少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含む、誘導体。
（項目２０）
細胞活性を制御する方法であって、該方法は、該制御を必要とするかまたは欲している生物に：
ａ）配列番号１８７～３６８のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含むペプチドを含む有効量の薬学的組成物を投与する工程を包含し、
ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、方法。
（項目２１）
前記細胞活性が、ｔｏｌｌ様レセプターによって媒介される、項目２０に記載の方法。
（項目２２）
ｔｏｌｌ様レセプターによって媒介される前記細胞活性が、ＴＮＦ－αの分泌である、項目２１に記載の方法。
（項目２３）
ＬＰＳおよび／またはＣｐＧ－ＯＤＮによる刺激後のＴＮＦ－α分泌の１０％、２０％、３０％、４０％、５０％、６０％、７０％、８０％または９０％の阻害をもたらす、項目２０～２２のいずれか１項に記載の方法。
（項目２４）
前記投与工程が、サイトカイン分泌の阻害をもたらす、項目２０～２３のいずれか１項に記載の方法。
（項目２５）
動物における炎症を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とするかまたは欲している動物に：
ａ）配列番号１８７～３６８のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含むペプチドを含む薬学的組成物を投与する工程を包含し、
ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、方法。
（項目２６）
前記炎症が、ウイルス、細菌、真菌、抗原、自己抗原またはそれらの組み合わせによって引き起こされる、項目２５に記載の方法。
（項目２７）
前記炎症が、耳の炎症である、項目２５または２６に記載の方法。
（項目２８）
前記炎症が、中耳炎である、項目２５～２７のいずれか１項に記載の方法。
（項目２９）
前記投与が、中耳炎の症状を低減させるかまたは除去する、項目２５～２８のいずれか１項に記載の方法。
（項目３０）
前記症状が、疼痛、耳漏、発熱、被刺激性、食欲不振、嘔吐または下痢である、項目２９に記載の方法。
（項目３１）
前記症状が、疼痛である、項目２９または３０に記載の方法。
（項目３２）
前記炎症が、皮膚、関節、筋組織、脳または結合組織の炎症である、項目２５または２６に記載の方法。
（項目３３）
前記炎症が、関節炎、皮膚炎、エリテマトーデス、髄膜炎または乾癬である、項目２５、２６および３２のいずれか１項に記載の方法。
（項目３４）

前記関節炎が、変形性関節症、関節リウマチ、化膿性関節炎、痛風、偽痛風、若年性特発性関節炎、スティル病または強直性脊椎炎である、項目３３に記載の方法。
（項目３５）
前記皮膚炎が、海綿状皮膚炎、小児湿疹、アレルギー性接触皮膚炎、脂漏性皮膚炎、汗疱状皮膚炎、じんま疹、小水疱性皮膚炎もしくは水疱性皮膚炎または丘疹状じんま疹である、項目３３に記載の方法。
（項目３６）
前記乾癬が、プラーク乾癬、屈側性乾癬、滴状乾癬、膿疱性乾癬、爪乾癬、乾癬性関節炎または乾癬性紅皮症である、項目３３に記載の方法。
（項目３７）
前記薬学的組成物が、局所適用によって投与される、項目２５～３６のいずれか１項に記載の方法。
（項目３８）
前記局所適用が、皮膚、毛、外耳、鼓膜、頬側前庭、鼻腔または舌下腔への適用を含む、項目３７に記載の方法。
（項目３９）
前記局所適用が、鼓膜への適用を含む、項目３７または３８に記載の方法。
（項目４０）
前記鼓膜への適用が、鼓膜への滴剤の適用を含む、項目３８または３９に記載の方法。
（項目４１）
前記動物が、ヒトである、項目２５～４０のいずれか１項に記載の方法。
（項目４２）
副鼻腔炎を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とするかまたは欲している生物にエアロゾル組成物を投与する工程を包含し、該エアロゾル組成物は：
ａ）配列番号１８７～３６９のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含む治療有効量のペプチドを含み、
ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、方法。
（項目４３）
動物における聴力を改善する方法であって、該方法は、中耳および／または内耳の炎症を有し、かつ聴力が低下した動物に：
ａ）配列番号１８７～３６９のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含む治療有効量のペプチドを投与する工程を包含し、
ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含み、ここで、該ペプチドは、局所的に投与され、該聴力は、普通レベルと変わらないレベルまで改善し、そして／または該聴力は、該ペプチドの投与なしに該聴力が改善するよりも速く改善する、方法。
（項目４４）
中耳および／または内耳の炎症を処置する方法であって、該方法は、該処置を必要とするかまたは欲している動物の鼓膜に：
ａ）配列番号１８７～３６９のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体を含む治療有効量のペプチドを投与する工程を包含し、
ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、方法。
（項目４５）
細胞活性を制御するための医薬の製造におけるペプチドの使用であって、該ペプチドは：
ａ）配列番号１８７～３６８のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含み、ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、使用。

（項目４６）
前記細胞活性が、ｔｏｌｌ様レセプターによって媒介される、項目４５に記載の使用。
（項目４７）
ｔｏｌｌ様レセプターによって媒介される前記細胞活性が、ＴＮＦ－αの分泌である、項目４６に記載の使用。
（項目４８）
前記医薬が、ＬＰＳおよび／またはＣｐＧ－ＯＤＮによる刺激後のＴＮＦ－α分泌の１０％、２０％、３０％、４０％、５０％、６０％、７０％、８０％または９０％の阻害をもたらす、項目４５～４７のいずれか１項に記載の使用。
（項目４９）
前記医薬が、サイトカイン分泌の阻害に適している、項目４５～４８のいずれか１項に記載の使用。
（項目５０）
動物における炎症を処置するための医薬の製造におけるペプチドの使用であって、該ペプチドは：
ａ）配列番号１８７～３６８のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含み、ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、使用。
（項目５１）
前記炎症が、ウイルス、細菌、真菌、抗原、自己抗原またはそれらの組み合わせによって引き起こされる、項目５０に記載の使用。
（項目５２）
前記炎症が、耳の炎症である、項目５０または５１に記載の使用。
（項目５３）
前記炎症が、中耳炎である、項目５０～５２のいずれか１項に記載の使用。
（項目５４）
前記医薬が、中耳炎の症状を低減させるかまたは除去する、項目５０～５３のいずれか１項に記載の使用。
（項目５５）
前記症状が、疼痛、耳漏、発熱、被刺激性、食欲不振、嘔吐または下痢である、項目５４に記載の使用。
（項目５６）
前記症状が、疼痛である、項目５４または５５に記載の使用。
（項目５７）
前記炎症が、皮膚、関節、筋組織、脳または結合組織の炎症である、項目５０または５１に記載の使用。
（項目５８）
前記炎症が、関節炎、皮膚炎、エリテマトーデス、髄膜炎または乾癬である、項目５０、５１および５７のいずれか１項に記載の使用。
（項目５９）
前記関節炎が、変形性関節症、関節リウマチ、化膿性関節炎、痛風、偽痛風、若年性特発性関節炎、スティル病または強直性脊椎炎である、項目５８に記載の使用。
（項目６０）
前記皮膚炎が、海綿状皮膚炎、小児湿疹、アレルギー性接触皮膚炎、脂漏性皮膚炎、汗疱状皮膚炎、じんま疹、小水疱性皮膚炎もしくは水疱性皮膚炎または丘疹状じんま疹である、項目５８に記載の使用。
（項目６１）
前記乾癬が、プラーク乾癬、屈側性乾癬、滴状乾癬、膿疱性乾癬、爪乾癬、乾癬性関節炎または乾癬性紅皮症である、項目５８に記載の使用。
（項目６２）

前記医薬が、局所適用に適している、項目５０～６１のいずれか１項に記載の使用。
（項目６３）
前記局所適用が、皮膚、毛、外耳、鼓膜、頬腔、鼻腔または舌下腔への適用を含む、項目６２に記載の使用。
（項目６４）
前記局所適用が、鼓膜への適用を含む、項目６２または６３に記載の使用。
（項目６５）
前記鼓膜への適用が、鼓膜への滴剤の適用を含む、項目６３または６４に記載の使用。
（項目６６）
前記動物が、ヒトである、項目５０～６５のいずれか１項に記載の使用。
（項目６７）
副鼻腔炎を処置するための医薬の製造におけるペプチドの使用であって、該医薬は、エアロゾル組成物を含み、該ペプチドは：
ａ）配列番号１８７～３６９のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含み、ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、使用。
（項目６８）
動物において聴力を改善するための医薬の製造におけるペプチドの使用であって、ここで、該動物は、中耳および／または内耳の炎症を有し、かつ聴力が低下しており、該ペプチドは：
ａ）配列番号１８７～３６９のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含み、ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含み、該医薬は、局所用の医薬である、使用。
（項目６９）
中耳および／または内耳の炎症を処置するための医薬の製造におけるペプチドの使用であって、ここで、該医薬は、該処置を必要とするかまたは欲している動物の鼓膜への投与に適しており、該ペプチドは：
ａ）配列番号１８７～３６９のうちのいずれか１つの配列；または
ｂ）少なくとも１つのＤ－アミノ酸残基を含むＰ１３の誘導体
を含み、ここで、該ペプチドは、必要に応じて、Ｃ末端に伝達配列をさらに含む、使用。