

【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28年12月22日(2016.12.22)

【公表番号】特表2016-501857(P2016-501857A)

【公表日】平成28年1月21日(2016.1.21)

【年通号数】公開・登録公報2016-005

【出願番号】特願2015-543431(P2015-543431)

【国際特許分類】

|        |       |           |
|--------|-------|-----------|
| C 07 K | 7/06  | (2006.01) |
| A 61 K | 38/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 1/18  | (2006.01) |
| A 61 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 61 P | 35/04 | (2006.01) |
| C 07 K | 7/08  | (2006.01) |

【F I】

|        |       |       |
|--------|-------|-------|
| C 07 K | 7/06  | Z N A |
| A 61 K | 37/02 |       |
| A 61 P | 1/18  |       |
| A 61 P | 35/00 |       |
| A 61 P | 35/04 |       |
| C 07 K | 7/08  |       |

【手続補正書】

【提出日】平成28年10月31日(2016.10.31)

【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】

・少なくともアミノ酸配列X<sub>1</sub>-R-W-H-X<sub>5</sub>(X<sub>1</sub>が、A、C、D、E、F、G、H、I、K、L、M、N、P、Q、R、S、T、V、WもしくはYを含む群から選択され、X<sub>5</sub>が、A、C、D、E、F、G、H、I、K、L、M、N、P、Q、R、S、T、V、WもしくはYを含む群から選択される)(配列番号1)を含むペプチドまたはこのペプチド模倣物、または  
 ・アミノ酸配列X<sub>1</sub>-X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-R-W-H-X<sub>11</sub>-X<sub>12</sub>-X<sub>13</sub>-X<sub>14</sub>(式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、X<sub>3</sub>、X<sub>4</sub>、X<sub>5</sub>、X<sub>6</sub>、X<sub>7</sub>、X<sub>11</sub>、X<sub>12</sub>、X<sub>13</sub>もしくはX<sub>14</sub>が、A、C、D、E、F、G、H、I、K、L、M、N、P、Q、R、S、T、V、WもしくはYを含む群から選択される)(配列番号7)の内の少なくとも5個の、6個の、7個の、8個の、9個の、10個の、11個の、12個の、13個のまたは14個のアミノ酸を含むペプチドであり、配列番号7の少なくともX<sub>7</sub>-R-W-H-X<sub>11</sub>(式中、X<sub>7</sub>およびX<sub>11</sub>が、A、C、D、E、F、G、H、I、K、L、M、N、P、Q、R、S、T、V、WもしくはYを含む群から選択される)を含むペプチドまたはこのペプチド模倣物

を含む化合物を含有するヒトの肺癌の処置のための医薬組成物。

【請求項2】

前記化合物が、

・少なくともアミノ酸配列X<sub>1</sub>-R-W-H-X<sub>5</sub>(式中、X<sub>1</sub>が、K、R、Nもしくは

QのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>5</sub>が、EもしくはDのような負荷電側鎖を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択される) (配列番号4) を含むペプチドまたはこのペプチド模倣物、または・アミノ酸配列X<sub>1</sub>-X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-R-W-H-X<sub>11</sub>-X<sub>12</sub>-X<sub>13</sub>-X<sub>14</sub>(式中、X<sub>1</sub>が、K、R、NもしくはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>2</sub>が、EもしくはDのような負荷電側鎖を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>3</sub>が、K、R、NもしくはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>4</sub>が、F、WもしくはYのような非極性側鎖もしくは非荷電側鎖と芳香環構造とを有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>5</sub>が、F、WもしくはYのような非極性側鎖もしくは非荷電側鎖と芳香環構造とを有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>6</sub>が、Gまたは、A、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>7</sub>が、K、R、NもしくはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>11</sub>が、EもしくはDのような負荷電側鎖を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>12</sub>が、Gまたは、A、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>13</sub>が、F、WもしくはYのような非極性側鎖もしくは非荷電側鎖と芳香環構造とを有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>14</sub>が、K、R、NもしくはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択される) (配列番号8) の内の少なくとも5個の、6個の、7個の、8個の、9個の、10個の、11個の、12個の、13個のまたは14個のアミノ酸を含むペプチドであり、配列番号8の少なくともX<sub>7</sub>-R-W-H-X<sub>11</sub>(式中、X<sub>7</sub>が、K、R、NもしくはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>11</sub>が、EもしくはDのような負荷電側鎖を有するアミノ酸、またはA、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択される) を含むペプチドまたはこのペプチド模倣物

を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

### 【請求項3】

前記化合物が、

- ・少なくともアミノ酸配列X<sub>1</sub>-R-W-H-X<sub>5</sub>(式中、X<sub>1</sub>が、K、R、NもしくはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>5</sub>が、EもしくはDのような負荷電側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択される) (配列番号5) 含むペプチドまたはこのペプチド模倣物、または・アミノ酸配列X<sub>1</sub>-X<sub>2</sub>-X<sub>3</sub>-X<sub>4</sub>-X<sub>5</sub>-X<sub>6</sub>-X<sub>7</sub>-R-W-H-X<sub>11</sub>-X<sub>12</sub>-X<sub>13</sub>-X<sub>14</sub>(式中、X<sub>1</sub>が、K、R、NまたはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>2</sub>が、EまたはDのような負荷電側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>3</sub>が、K、R、NまたはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>4</sub>が、F、WまたはYのような非極性側鎖または非荷電側鎖と芳香環構造とを有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>5</sub>が、F、WまたはYのような非極性側鎖または非荷電側鎖と芳香環構造とを有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>6</sub>が、Gまたは、A、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>7</sub>が、K、R、NまたはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>11</sub>が、EまたはDのような負荷電側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択され、X<sub>12</sub>が、Gまたは、A、V、LもしくはIのような非極性側鎖を有するアミノ酸

を含む群から選択され、 $X_{1\sim 3}$ が、F、WまたはYのような非極性側鎖または非荷電側鎖と芳香環構造とを有するアミノ酸を含む群から選択され、 $X_{1\sim 4}$ が、K、R、NまたはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸を含む群から選択される) (配列番号9) の内の少なくとも5個の、6個の、7個の、8個の、9個の、10個の、11個の、12個の、13個のまたは14個のアミノ酸を含むペプチドであり、配列番号9の少なくとも $X_7$ -R-W-H-X<sub>1~1</sub>(式中、 $X_7$ が、K、R、NまたはQのようなNH<sub>2</sub>基を有するアミノ酸を含む群から選択され、 $X_{1\sim 1}$ が、EまたはDのような負荷電側鎖を有するアミノ酸を含む群から選択される)を含むペプチドまたはこのペプチド模倣物を含む、請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記化合物が、アミノ酸配列N-R-W-H-E(配列番号2)、アミノ酸配列K-E-Q-W-F-G-N-R-W-H-E-G-Y-R(配列番号6)を含む、場合により、からなるペプチドまたはこのペプチド模倣物を含む、請求項1、2または3のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記化合物が前記ペプチドまたは前記ペプチド模倣物の改変型である、請求項1、2、3または4のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記化合物が、前記ペプチドまたはペプチド模倣物のペグ化型、ヘシリ化型、パシリ化型、ミリストイル化型、グリコシリ化型および/または環状型である、請求項5に記載の医薬組成物。

【請求項7】

化合物が経口投与用に、経鼻投与用にまたは皮下投与用に製剤化されている、請求項1、2、3、4または5のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項8】

前記膵癌が転移をまだ形成していない、請求項1、2、3、4、5、6または7のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項9】

前記膵癌が転移を既に形成している、請求項1、2、3、4、5、6または7のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記膵癌が、対癌米国合同委員会の癌病期分類システムのTNM解剖学的/予後群システムに従ってステージIVと分類できる、請求項1、2、3、4、5、6または7のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項11】

膵癌が膵外分泌癌または膵内分泌癌である、請求項8、9または10のいずれかに記載の医薬組成物。