

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2005-506276 (P2005-506276A)

【公表日】平成 17 年 3 月 3 日 (2005.3.3)

【年通号数】公開・登録公報 2005-009

【出願番号】特願 2002-551990 (P2002-551990)

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 38/00

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/14

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00

【F I】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/14

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 0 5

【手続補正書】

【提出日】平成 16 年 12 月 10 日 (2004.12.10)

【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】

複合体分子を肥満細胞に輸送する能力のある第 1 部分と、該肥満細胞内で抗アレルギー効果を表す第 2 部分とを少なくとも有する複合体分子を含む抗アレルギー剤であって、前

記第 1 部分はリンカーによって前記第 2 部分に結合しており、前記第 2 部分が G_{i_3} 由来の抗アレルギー性デカペプチドである場合に、前記第 1 部分がペプチド A A V A L L P A V L L A L L A P 以外のものであるという条件付きで、前記リンカーが 2 部分の間の連結部又はその近傍に屈曲又は回転をもたらしている抗アレルギー剤。

【請求項 2】

前記第 2 部分が、少なくとも前記肥満細胞の脱顆粒を有意に減少させることによって前記抗アレルギー効果を有する請求項 1 に記載の薬剤。

【請求項 3】

前記第 2 部分が、ペプチド、ペプチド様物質、又はポリペプチドから成る群から選択される請求項 2 に記載の抗アレルギー剤。

【請求項 4】

前記第 2 部分が、水素結合、イオン結合及び共有結合から成る群から選択された結合によって安定化した環状構造を有するペプチドである請求項 3 に記載の抗アレルギー剤。

【請求項 5】

前記第 1 部分が、ペプチドである請求項 3 に記載の抗アレルギー剤。

【請求項 6】

前記リンカーが、共有結合である請求項 5 に記載の抗アレルギー剤。

【請求項 7】

前記共有結合が、ペプチド結合である請求項 6 に記載の抗アレルギー剤。

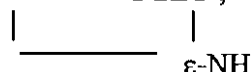
【請求項 8】

前記第 2 の抗アレルギー部分が、

配列 KNNLKECGLY を有する G_{ai_3} 由来のデカペプチド、

配列 KENLKDCGLF を有する G_{at} 由来のデカペプチド、

環状 G_{ai_3} KNNLKECGLY;



KNNLKECGL-パラ-アミノ-F; KQNLKECGLY; KSNLKECGLY;

KNNLKEVGLY および KENLKECGLY.

から成る群から選択されたアミノ酸配列を有する請求項 7 に記載の抗アレルギー剤。

【請求項 9】

前記第 2 の抗アレルギー部分が、 G_{i_3} の C 末端配列から得られるペプチドである請求項 7 に記載の抗アレルギー剤。

【請求項 10】

前記分子が、

WALL006: AAVALLPAVLLALLAPKQNLKECGLY

WALL007: AAVALLPAVLLALLAPKNNLKEVGLY

WALL008: スクシニル-AAVALLPAVLLALLA-Sar-KNNLKECGLY

WALL010: VTVLALGALAGVGVGPKNLKECGLY

WALL011: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKSNLKECGLY

WALL012: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKENLKECGLY

WALL013: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKANLKECGLY

WALL014: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAP KNNLKECGL-パラ-アミノ-F

WALL015: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKQNLKECGLY

WALL016: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKNNLKEVGLY

から成る群から選択されたアミノ酸配列を有するペプチド、ならびにこれら配列の活性の類似体、相同体、及び環状誘導体を含む誘導体である請求項 7 に記載の抗アレルギー剤。

【請求項 1 1】

被験対象のアレルギー状態を治療するための医薬組成物であって、治療有効量の抗アレルギー剤を含み、前記抗アレルギー剤は複合体分子を肥満細胞に輸送する能力のある第 1 部分と前記肥満細胞内で抗アレルギー効果を表す第 2 部分とを少なくとも有する複合体分子を含み、前記第 1 部分はリンカーによって前記第 2 部分に結合しており、前記第 2 部分が G_i 由来の抗アレルギー性デカペプチドであるときには、前記第 1 部分はペプチド AAVALLPAVLLALLAP 以外であるという条件付で、前記リンカーが 2 つの部分の間の連結部又はその近傍に屈曲又は回転をもたらしている、医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記アレルギー状態が、アレルギー性鼻炎、被験対象の目のアレルギー反応、被験対象の皮膚のアレルギー反応、急性蕁麻疹、乾癬、心因性若しくはアレルギー性の喘息、間質性膀胱炎、腸疾患、偏頭痛及び多発硬化症から成る群から選択される請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

薬剤として許容される添加物、希釈剤又は担体をさらに含む請求項 1 1 又は 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

前記組成物が、局所投与に適している請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

前記局所投与が、被験対象の皮膚に対するものである請求項 1 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記組成物が、鼻腔内投与又は吸入に適している請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

前記第 2 部分が、少なくとも前記肥満細胞の脱顆粒を有意に減少させることによって前記抗アレルギー効果を有する請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記第 2 部分が、ペプチド、ペプチド様物質、又はポリペプチドから成る群から選択された請求項 1 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記第 2 部分が、環状構造を有し、水素結合、イオン結合及び共有結合から成る群から選択された結合によって安定化されたペプチドである請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

前記第 1 部分が、ペプチドである請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

前記リンカーが、共有結合である請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記共有結合が、ペプチド結合である請求項 21 に記載の医薬組成物。

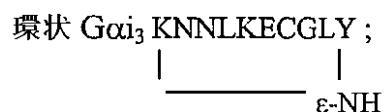
【請求項 23】

前記第 2 の抗アレルギー部分が、

配列 KNNLKECGLY を有する $G\alpha i_3$ 由来のデカペプチド、

配列 KNNLKECGLY を有する $G\alpha i_3$ 由来のデカペプチド、

配列 KENLKDCGLF を有する $G\alpha t$ 由来のデカペプチド、



KNNLKECGL-パラ-アミノ-F; KQNLKECGLY; KSNLKECGLY;

KNNLKEVGLY および KENLKECGLY.

から成る群から選択されたアミノ酸配列を有する請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記第 2 の抗アレルギー部分が、 $G\alpha i_3$ の C 末端配列から得られたペプチドである請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記分子が、

WALL006: AAVALLPAVLLALLAPKQNLKECGLY

WALL007: AAVALLPAVLLALLAPKNNLKEVGly

WALL008: スクシニル-AAVALLPAVLLALLA-Sar-KNNLKECGLY

WALL010: VTVLALGALAGVGVGPKNNLKECGLY

WALL011: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKSNLKECGLY

WALL012: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKENLKECGLY

WALL013: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKANLKECGLY

WALL014: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAP KNNLKECGL-パラ-アミノ-F

WALL015: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKQNLKECGLY

WALL016: スクシニル-AAVALLPAVLLALLAPKNNLKEVGly

並びにこれらの配列の活性の類似体、相同体、及び環状誘導体を含む誘導体から成る群から選択されたアミノ酸配列を有するペプチドである請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

複合体分子を肥満細胞に輸送する能力のある第1部分と、該肥満細胞内で抗アレルギー効果を表す第2部分とを少なくとも有する複合体分子を含む抗アレルギー剤の、アレルギー状態を治療するための医薬を製造するための使用であって、

該第1部分はリンカーによって該第2部分に結合しており、

該第2部分が G_i3 由来の抗アレルギー性デカペプチドであるとき、該第1部分はペプチド AAVALLPAVLLALLAP 以外であるという条件で、該リンカーが、該部分の間の連結部又はその近傍に屈曲又は回転をもたらす、上記使用。

【請求項 27】

前記アレルギー状態が、アレルギー性鼻炎、被験対象の目のアレルギー反応、被験対象の皮膚のアレルギー反応、急性蕁麻疹、乾癬、心因性若しくはアレルギー性の喘息、間質性膀胱炎、腸疾患、偏頭痛及び多発硬化症から成る群から選択される請求項 26 に記載の使用。

【請求項 28】

前記医薬が局所投与用である、請求項 26 又は 27 に記載の使用。

【請求項 29】

前記局所投与が、被験対象の皮膚又は目に対するものである請求項 28 に記載の使用。

【請求項 30】

前記医薬が吸入投与用又は鼻腔内投与用である、請求項 26 又は 27 に記載の使用

【請求項 31】

前記第2部分が、少なくとも前記肥満細胞の脱顆粒を有意に減少させることによって前記抗アレルギー効果を有する請求項 26 に記載の使用。

【請求項 32】

前記第2部分が、ペプチド、ペプチド様物質及びポリペプチドから成る群から選択される請求項 31 に記載の使用。

【請求項 33】

前記第2部分が、水素結合、イオン結合及び共有結合から成る群から選択される結合によって安定化された、環状構造を有するペプチドである請求項 32 に記載の使用。

【請求項 3 4】

前記第 1 部分がペプチドである、請求項 3 2 に記載の 使用。

【請求項 3 5】

前記リンカーが共有結合である、請求項 3 4 に記載の 使用。

【請求項 3 6】

前記共有結合がペプチド結合である、請求項 3 5 に記載 使用。

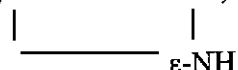
【請求項 3 7】

前記第 2 の抗アレルギー部分が、

配列 KNNLKECGLY を有する $G\alpha_{i3}$ 由来のデカペプチド、

配列 KENLKDCGLF を有する $G\alpha_t$ 由来のデカペプチド、

環状 $G\alpha_{i3}$ KNNLKECGLY ;



KNNLKECGL-パラ-アミノ-F; KQNLKECGLY;

KSNLKECGLY; KNNLKEVGly および KENLKECGLY.

KSNLKECGLY; KNNLKEVGly および KENLKECGLY.

から成る群から選択されるアミノ酸配列を有する、請求項 3 5 に記載の 使用。

【請求項 3 8】

前記第 2 の抗アレルギー部分が、 G_{i3} の C 末端配列から得られるペプチドである、請求項 3 6 に記載の 使用。

【請求項 3 9】

前記分子が、

WALL006: AAVALLPAVLLALLAPKQNLKECGLY

WALL007: AAVALLPAVLLALLAPKNNLKEVGly

WALL008: スクシニル -AAVALLPAVLLALLA-Sar-KNNLKECGLY

WALL010: VTVLALGALAGVGVPKNNLKECGLY

WALL011: スクシニル -AAVALLPAVLLALLAPKSNLKECGLY

WALL012: スクシニル -AAVALLPAVLLALLAPKENLKECGLY

WALL013: スクシニル -AAVALLPAVLLALLAPKANLKECGLY

WALL014: スクシニル -AAVALLPAVLLALLAP KNNLKECGL-パラ-アミノ-F

WALL015: スクシニル -AAVALLPAVLLALLAPKQNLKECGLY

WALL016: スクシニル -AAVALLPAVLLALLAPKNNLKEVGly

ならびにこれら配列の活性の類似体、相同体、及び環状誘導体を含めた誘導体から成る群

から選択されるアミノ酸配列を有するペプチドである、請求項 36 に記載の使用。

【請求項 40】

分子を肥満細胞に輸送する能力のある第 1 部分と該肥満細胞内で抗アレルギー効果を表す第 2 部分とを少なくとも有する複合分子を含む抗アレルギー剤の、蛋白質キナーゼ活性化によって誘導される遅延型炎症応答を防ぐための医薬を調製するための使用であって、

該第 1 部分はリンカーによって該第 2 部分に結合しており、

該リンカーは該部分の間の連結部又はその近傍に屈曲又は回転をもたらしている、上記使用。

【請求項 41】

前記蛋白質キナーゼ活性が、マイトジェン活性化蛋白質キナーゼである請求項 40 に記載の使用。

【請求項 42】

前記抗アレルギー剤が、請求項 1 から 10 までのいずれか 1 項に記載されているものである請求項 40 に記載の使用。

【請求項 43】

前記抗アレルギー剤が、ペプチド 2、ペプチド 2 - S u c c 及びペプチド 2 - C y s から成る群から選択される請求項 40 に記載の使用。

【請求項 44】

i n v i v oでの抗アレルギー性ペプチドの被験対象の細胞への輸送を促進するための輸送ペプチドであって、

該ペプチドが、屈曲又は回転を形成するリンカー又は直接結合によって、該抗アレルギー性ペプチドに結合されて、複合ペプチド又はペプチド様分子を形成するリーダー配列を含み、

該抗アレルギー性ペプチドが G i₃由来の抗アレルギーデカペプチドであるときに、前記第 1 部分がペプチド A A V A L L P A V L L A L L A P 以外であるという条件で、前記複合体分子を、前記リーダー配列によって細胞に輸送し、それによって該抗アレルギー性ペプチドを細胞に輸送することを可能にする輸送ペプチド。