【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4年9月9日(2022.9.9)

【国際公開番号】WO2020/055824
【公表番号】特表2022-500500(P2022-500500A)
【公表日】令和4年1月4日(2022.1.4)
【出願番号】特願2021-538171(P2021-538171)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ 38/08(2019.01)
Ａ６１Ｋ 38/10(2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/14(2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/72(2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/06(2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06(2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00(2006.01)
Ｃ０７Ｋ 7/06(2006.01)
Ｃ０７Ｋ 7/08(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ 38/08
Ａ６１Ｋ 38/10 ＺＮＡ
Ａ６１Ｋ 9/14
Ａ６１Ｋ 9/72
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 37/06
Ａ６１Ｐ 11/00
Ａ６１Ｐ 31/00
Ａ６１Ｐ 11/06
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １２１
Ｃ０７Ｋ 7/06
Ｃ０７Ｋ 7/08

【手続補正書】
【提出日】令和4年9月1日(2022.9.1)
【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】
ペプチドの乾燥粉末を含む医薬組成物であって、前記ペプチドは、配列番号２～２０のうちのいずれか１つから選択されるアミノ酸配列を含む、医薬組成物。
【請求項２】
前記ペプチドが、７～２０のアミノ酸長である、請求項１に記載の医薬組成物。

【請求項３】
前記ペプチドが、配列番号２のアミノ酸配列を含む、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項４】
前記ペプチドが：
（ａ）配列番号２のＮ末端に付加された少なくとも１つのアミノ酸を含むか；
（ｂ）配列番号２のＣ末端に付加された少なくとも１つのアミノ酸を含むか；または
（ｃ）配列番号２のＮ末端およびＣ末端に付加された少なくとも１つのアミノ酸を含む、
請求項３に記載の医薬組成物。
【請求項５】
前記ペプチドが：
（ａ）Ｌ－アミノ酸を含むか；
（ｂ）Ｄ－アミノ酸を含むか；または
（ｃ）Ｌ－アミノ酸およびＤ－アミノ酸を含む、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項６】
前記ペプチドが、少なくとも１つの重水素化残基を含む、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項７】
前記ペプチドが、少なくとも１つの非標準アミノ酸を含む、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項８】
前記非標準アミノ酸が、オルニチンである、請求項７に記載の医薬組成物。
【請求項９】
前記ペプチドが：
（ａ）Ｎ末端修飾を含むか；
（ｂ）Ｃ末端修飾を含むか；または
（ｃ）Ｎ末端修飾およびＣ末端修飾を含む、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項１０】
前記Ｎ末端修飾が、アシル化である、かつ／または
前記Ｃ末端修飾が、アミド化である、請求項９に記載の医薬組成物。
【請求項１１】
前記ペプチドが、配列番号３～２０のうちのいずれか１つからから選択されるアミノ酸配列を含む、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項１２】
前記ペプチドが、配列番号８のアミノ酸配列を含む、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項１３】
細胞透過性ペプチド（ＣＰＰ）をさらに含む、請求項１～１２のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１４】
前記ＣＰＰが、ＧＲＫＫＲＲＱＲＲＲＰＰＱ（配列番号２３）、ＲＱＩＫＩＷＦＱＮＲＲＭＫＷＫＫ（配列番号２４）、およびＧＩＧＡＶＬＫＶＬＴＴＧＬＰＡＬＩＳＷＩＫＲＫＲＱＱ（配列番号２５）からなる群から選択されるアミノ酸配列を含む、請求項１３に記載の医薬組成物。
【請求項１５】
前記ペプチドが、配列番号２～２０のうちのいずれか１つから選択されるアミノ酸配列の少なくとも２つの反復を含む、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項１６】
前記乾燥粉末が、粉砕プロセスまたは噴霧乾燥プロセスによって製造される、請求項１～１５のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１７】
前記乾燥粉末が、エアジェット粉砕、ボール粉砕、または湿式粉砕によって製造される

、請求項１６に記載の医薬組成物。
【請求項１８】
前記乾燥粉末が、１０（重量）％未満の水を含む、請求項１～１７のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１９】
前記乾燥粉末が、１（重量）％未満の水を含む、請求項１～１７のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項２０】
前記乾燥粉末が、配列番号２～２０のうちのいずれか１つから選択されるアミノ酸配列からなる、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項２１】
前記医薬組成物が、肺送達用に製剤化されている、請求項１～２０のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項２２】
前記医薬組成物が、乾燥粉末吸入用に、加圧式定量吸入用に、または霧化用に製剤化されている、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項２３】
前記医薬組成物が、経口投与用、局所投与用、または注射用に製剤化されている、請求項１～２０のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項２４】
その必要のある対象を治療するための、請求項１～２３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項２５】
前記対象が、炎症性障害を有する、請求項２４に記載の医薬組成物。
【請求項２６】
前記対象が、線維性状態を有する、請求項２４に記載の医薬組成物。
【請求項２７】
前記対象が、肺炎症、慢性閉塞性肺障害（ＣＯＰＤ）、急性肺傷害、肺感染症、化学物質誘発性肺傷害、鋳型気管支炎、喘息、急性呼吸窮迫症候群（ＡＲＤＳ）、吸入煙誘発性急性肺傷害（ＩＳＡＬＩ）、細気管支炎、閉塞性細気管支炎、肺の線維性状態、間質性肺疾患、特発性肺線維症（ＩＰＦ）、または肺瘢痕化を有する、請求項２４に記載の医薬組成物。
【請求項２８】
前記対象が、間質性肺疾患を有する、請求項２４に記載の医薬組成物。
【請求項２９】
乾燥粉末吸入により前記対象に投与される、請求項２４に記載の医薬組成物。
【請求項３０】
前記医薬組成物を含む溶液を霧化することにより前記対象に投与される、請求項２４に記載の医薬組成物。
【請求項３１】
少なくとも１つの追加の抗線維化治療薬と共に前記対象に投与される、請求項２４に記載の医薬組成物。
【請求項３２】
前記少なくとも１つの追加の抗線維症薬が、非ステロイド性抗炎症薬（ＮＳＡＩＤ）、ステロイド、疾患修飾性抗リウマチ薬（ＤＭＡＲＤ）、免疫抑制剤、生物学的応答モジュレーター、または気管支拡張剤である、請求項３１に記載の医薬組成物。
【請求項３３】
前記対象が、ヒトである、請求項２４～３２のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項３４】
前記乾燥粉末が、５μｍ未満のサイズの粒子を含む、請求項１～２３のいずれか一項に記

載の医薬組成物。
【請求項３５】
前記ペプチドが配列番号８のアミノ酸配列からなる、請求項１または１６～２３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０２０９
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０２０９】
以下の参考文献は、本明細書に示されるものに対して補助的に例示的な手順または他の詳細を与える程度まで、本明細書に参照により組み込まれる。
Ｃａｒｖａｌｈｏ ｅｔ ａｌ．，“Ｉｎｆｌｕｅｎｃｅ ｏｆ ｐａｒｔｉｃｌｅ ｓｉｚｅ ｏｎ ｒｅｇｉｏｎａｌ ｌｕｎｇ ｄｅｐｏｓｉｔｉｏｎ － Ｗｈａｔ ｅｖｉｄｅｎｃｅ ｉｓ ｔｈｅｒｅ？”Ｉｎｔ．Ｊ．Ｐｈａｒｍａ．４０６：１－１０，２０１１．
Ｈｕｅｂｎｅｒ，Ｒ．－Ｈ．；Ｇｉｔｔｅｒ，Ｗ．；Ｅｌ Ｍｏｋｈｔａｒｉ，Ｎ．Ｅ．；Ｍａｔｈｉａｋ，Ｍ．；Ｂｏｔｈ，Ｍ．；Ｂｏｌｔｅ，ＥＬ；Ｆｒｅｉｔａｇ－Ｗｏｌｆ，Ｓ．；Ｂｅｗｉｇ，Ｂ．Ｓｔａｎｄａｒｄｉｚｅｄ ｑｕａｎｔｉｆｉｃａｔｉｏｎ ｏｆ ｐｕｌｍｏｎａｒｙ ｆｉｂｒｏｓｉｓ ｉｎ ｈｉｓｔｏｌｏｇｉｃａｌ ｓａｍｐｌｅｓ．Ｂｉｏｔｅｃｈｎｉｑｕｅｓ，４４，５０７－１１，５１４－７，２００８．
Ｓｕｒａｓａｒａｎｇ ｅｔ ａｌ．，“Ｏｐｔｉｍｉｚａｔｉｏｎ ｏｆ Ｆｏｒｍｕｌａｔｉｏｎ ｆｏｒ ａ Ｎｏｖｅｌ Ｉｎｈａｌｅｄ Ｃａｎｄｉｄａｔｅ Ｔｈｅｒａｐｅｕｔｉｃ ｆｏｒ Ｉｄｉｏｐａｔｈｉｃ Ｆｉｂｒｏｓｉｓ，”Ｄｒｕｇ Ｄｅｖｅｌｏｐｍｅｎｔ ａｎｄ Ｉｎｄｕｓｔｒｉａｌ Ｐｈａｒｍａｃｙ，４４（２）：１８４－１９８，２０１７．
Ｔｅｐｐｅｒ，Ｊ．Ｓ．；Ｋｕｅｈｌ，Ｐ．Ｊ．；Ｃｒａｃｋｎｅｌｌ，Ｓ．；Ｎｉｋｕｌａ，Ｋ．Ｊ．；Ｐｅｉ，Ｌ．；Ｂｌａｎｃｈａｒｄ，Ｊ．Ｄ．Ｓｙｍｐｏｓｉｕｍ Ｓｕｍｍａｒｙ：“ｂｒｅａｔｈｅ Ｉｎ，Ｂｒｅａｔｈｅ Ｏｕｔ，Ｉｔｓ Ｅａｓｙ：Ｗｈａｔ Ｙｏｕ Ｎｅｅｄ ｔｏ Ｋｎｏｗ ａｂｏｕｔ Ｄｅｖｅｌｏｐｉｎｇ Ｉｎｈａｌｅｄ Ｄｒｕｇｓ．”Ｉｎｔ．Ｊ．Ｔｏｘｉｃｏｌ．３５，３７６－３９２，２０１６．
本発明は、例えば以下の項目を提供する。
(項目１)
ペプチドの乾燥粉末を含む医薬組成物であって、前記ペプチドは、配列番号２～２０のうちのいずれか１つの配列を含む、医薬組成物。
(項目２)
前記ペプチドが、７～２０のアミノ酸長である、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３)
前記ペプチドが、配列番号２のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４)
前記ペプチドが、配列番号２のペプチドのＮ末端に付加された少なくとも１つのアミノ酸を含む、項目３に記載の医薬組成物。
(項目５)
前記ペプチドが、配列番号２のペプチドのＣ末端に付加された少なくとも１つのアミノ酸を含む、項目３に記載の医薬組成物。
(項目６)
前記ペプチドが、配列番号２のペプチドのＮ末端およびＣ末端に付加された少なくとも１つのアミノ酸を含む、項目３に記載の医薬組成物。

(項目７)
前記ペプチドが、Ｌ－アミノ酸を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目８)
前記ペプチドが、Ｄ－アミノ酸を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目９)
前記ペプチドが、Ｌ－アミノ酸およびＤ－アミノ酸の両方を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目１０)
前記ペプチドが、少なくとも１つの重水素化残基を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目１１)
前記ペプチドが、少なくとも１つの非標準アミノ酸を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目１２)
前記ペプチドが、２つの非標準アミノ酸を含む、項目１１に記載の医薬組成物。
(項目１３)
前記非標準アミノ酸が、オルニチンである、項目１１に記載の医薬組成物。
(項目１４)
前記ペプチドが、Ｎ末端修飾を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目１５)
前記ペプチドが、Ｃ末端修飾を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目１６)
前記ペプチドが、Ｎ末端修飾およびＣ末端修飾を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目１７)
前記Ｎ末端修飾が、アシル化である、項目１４に記載の医薬組成物。
(項目１８)
前記Ｃ末端修飾が、アミド化である、項目１５に記載の医薬組成物。
(項目１９)
前記ペプチドが、配列番号３のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２０)
前記ペプチドが、配列番号４のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２１)
前記ペプチドが、配列番号６のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２２)
前記ペプチドが、配列番号９のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２３)
前記ペプチドが、配列番号５のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２４)
前記ペプチドが、配列番号７のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２５)
前記ペプチドが、配列番号８のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２６)
前記ペプチドが、配列番号１１のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２７)
前記ペプチドが、配列番号１２のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２８)
前記ペプチドが、配列番号１３のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目２９)
前記ペプチドが、配列番号１４のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３０)
前記ペプチドが、配列番号１５のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３１)

前記ペプチドが、配列番号１６のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３２)
前記ペプチドが、配列番号１７のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３３)
前記ペプチドが、配列番号１８のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３４)
前記ペプチドが、配列番号１９のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３５)
前記ペプチドが、配列番号１０のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３６)
前記ペプチドが、配列番号２０のアミノ酸配列を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３７)
細胞透過性ペプチド（ＣＰＰ）をさらに含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目３８)
前記ＣＰＰが、ＧＲＫＫＲＲＱＲＲＲＰＰＱ（配列番号２３）、ＲＱＩＫＩＷＦＱＮＲＲＭＫＷＫＫ（配列番号２４）、およびＧＩＧＡＶＬＫＶＬＴＴＧＬＰＡＬＩＳＷＩＫＲＫＲＱＱ（配列番号２５）を含む群から選択されるアミノ酸配列を含む、項目３７に記載の医薬組成物。
(項目３９)
前記ペプチドが、配列番号２～２０のうちのいずれか１つの配列の少なくとも２つの反復を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４０)
前記少なくとも２つの反復が、同一のアミノ酸配列を有する、項目３９に記載の医薬組成物。
(項目４１)
前記少なくとも２つの反復が、異なるアミノ酸配列を有する、項目３９に記載の医薬組成物。
(項目４２)
前記乾燥粉末が、粉砕プロセスによって製造される、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４３)
前記乾燥粉末が、噴霧乾燥プロセスによって製造される、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４４)
前記乾燥粉末が、エアジェット粉砕によって製造される、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４５)
前記乾燥粉末が、ボール粉砕によって製造される、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４６)
前記乾燥粉末が、湿式粉砕によって製造される、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４７)
前記乾燥粉末が、１０（重量）％未満の水を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４８)
前記乾燥粉末が、１（重量）％未満の水を含む、項目１に記載の医薬組成物。
(項目４９)
前記医薬組成物が、本質的に賦形剤を含まない、項目１に記載の医薬組成物。
(項目５０)
前記医薬組成物が、賦形剤を含まない、項目４９に記載の医薬組成物。
(項目５１)
前記医薬組成物が、肺送達用に製剤化されている、項目１に記載の医薬組成物。
(項目５２)
前記医薬組成物が、乾燥粉末吸入用に製剤化されている、項目５１に記載の医薬組成物。
(項目５３)

前記医薬組成物が、吸入加圧式定量吸入用に製剤化されている、項目５１に記載の医薬組成物。
(項目５４)
前記医薬組成物が、経口投与用、局所投与用、または注射用に製剤化されている、項目１に記載の医薬組成物。
(項目５５)
項目１～５１に記載の医薬組成物を含む、ネブライザーデバイス。
(項目５６)
対象を治療する方法であって、前記対象に有効量の項目１～５１に記載の医薬組成物を前記対象に投与することを含む、方法。
(項目５７)
前記対象が、炎症性障害を有する、項目５６に記載の方法。
(項目５８)
前記対象が、線維性状態を有する、項目５６に記載の方法。
(項目５９)
前記対象が、肺炎症、急性肺傷害、肺感染症、または肺を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６０)
前記対象が、肺炎症を有する、項目５９に記載の方法。
(項目６１)
前記対象が、慢性閉塞性肺障害（ＣＯＰＤ）を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６２)
前記対象が、急性肺傷害または感染症を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６３)
前記対象が、肺感染症を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６４)
前記対象が、化学物質誘発性肺傷害を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６５)
前記対象が、鋳型気管支炎を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６６)
前記対象が、喘息を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６７)
前記対象が、急性呼吸窮迫症候群（ＡＲＤＳ）を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６８)
前記対象が、吸入煙誘発性急性肺傷害（ＩＳＡＬＩ）を有する、項目５６に記載の方法。
(項目６９)
前記対象が、細気管支炎を有する、項目５６に記載の方法。
(項目７０)
前記対象が、閉塞性細気管支炎を有する、項目５６に記載の方法。
(項目７１)
前記肺疾患が、肺の線維性状態である、項目５６に記載の方法。
(項目７２)
前記肺疾患が、間質性肺疾患である、項目５６に記載の方法。
(項目７３)
前記肺疾患が、特発性肺線維症（ＩＰＦ）または肺瘢痕化である、項目５６に記載の方法。
(項目７４)
前記投与が、乾燥粉末吸入を含む、項目５６に記載の方法。
(項目７５)
前記投与が、変異体ポリペプチドを含む溶液を霧化することを含む、項目５６に記載の

方法。
(項目７６)
少なくとも１つの追加の抗線維化治療薬を投与することをさらに含む、項目５６に記載の方法。
(項目７７)
前記少なくとも１つの追加の抗線維症薬が、ＮＳＡＩＤ、ステロイド、ＤＭＡＲＤ、免疫抑制剤、生物学的応答モジュレーター、または気管支拡張剤である、項目７６に記載の方法。
(項目７８)
前記対象が、ヒトである、項目５６に記載の方法。
(項目７９)
呼吸可能な粒子サイズを有する、粉砕された乾燥粉末として製剤化された、配列番号２～２０のペプチドを含む、医薬組成物。
(項目８０)
対象を治療する方法であって、有効量の項目７９に記載の組成物を吸入により前記対象に投与することを含む、方法。