

【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18年11月30日(2006.11.30)

【公表番号】特表2006-508179(P2006-508179A)

【公表日】平成18年3月9日(2006.3.9)

【年通号数】公開・登録公報2006-010

【出願番号】特願2005-501402(P2005-501402)

【国際特許分類】

C 07 K	7/08	(2006.01)
A 61 K	31/22	(2006.01)
A 61 K	31/366	(2006.01)
A 61 K	31/40	(2006.01)
A 61 K	31/405	(2006.01)
A 61 K	31/4418	(2006.01)
A 61 K	31/47	(2006.01)
A 61 K	31/505	(2006.01)
A 61 P	3/04	(2006.01)
A 61 P	3/06	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	9/08	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)
A 61 P	9/12	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	17/02	(2006.01)
A 61 P	19/00	(2006.01)
A 61 P	19/10	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)
A 61 P	25/28	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	31/18	(2006.01)
A 61 P	37/04	(2006.01)
A 61 P	39/02	(2006.01)
A 61 P	39/06	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 K	38/00	(2006.01)

【F I】

C 07 K	7/08
A 61 K	31/22
A 61 K	31/366
A 61 K	31/40
A 61 K	31/405
A 61 K	31/4418
A 61 K	31/47
A 61 K	31/505
A 61 P	3/04
A 61 P	3/06
A 61 P	3/10

A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 9/08  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 9/12  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 17/02  
A 6 1 P 19/00  
A 6 1 P 19/10  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 31/18  
A 6 1 P 37/04  
A 6 1 P 39/02  
A 6 1 P 39/06  
A 6 1 P 43/00 1 2 1  
A 6 1 K 37/02 Z N A

**【手続補正書】**

【提出日】平成18年10月11日(2006.10.11)

**【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】**

E - W - F - K - A - F - Y - E - K - V - A - E - K - F - K - E - A - F (配列番号 : 8 6 )、  
D - W - F - K - A - F - Y - D - K - V - A - E - K - F (配列番号 : 8 7 )、  
F - K - A - F - Y - D - K - V - A - E - K - F - K - E (配列番号 : 8 8 )、  
F - K - A - F - Y - E - K - V - A - E - K - F - K - E (配列番号 : 8 9 )、  
F - K - A - F - Y - D - K - V - A - E - K - F - K - E (配列番号 : 9 0 )、  
F - K - A - F - Y - E - K - V - A - E - K - F - K - E (配列番号 : 9 1 )、  
D - W - F - K - A - F - Y - D - K - V - A - E - K - F - K - E - A - F (配列番号 : 9 2 )、  
E - W - F - K - A - F - Y - E - K - V - A - E - K - F - K - E - A - F (配列番号 : 9 3 )、  
A - F - Y - D - K - V - A - E - K - F - K - E - A - F (配列番号 : 9 4 )、  
D - W - F - K - A - F - Y - D - K - V - A - E - K - F (配列番号 : 9 5 )、  
D - W - L - K - A - F - Y - D - K - V - F - E - K - F - K - E - F - F (配列番号 : 9 6 )、  
E - W - L - K - A - F - Y - E - K - V - F - E - K - F - K - E - F - F (配列番号 : 9 7 )、  
A - F - Y - D - K - V - F - E - K - F - K - E - F - F (配列番号 : 9 8 )、  
A - F - Y - E - K - V - F - E - K - F - K - E - F - F (配列番号 : 9 9 )、  
D - W - L - K - A - F - Y - D - K - V - F - E - K - F (配列番号 : 1 0 0 )、  
E - W - L - K - A - F - Y - E - K - V - F - E - K - F (配列番号 : 1 0 1 )、

L - K - A - F - Y - D - K - V - F - E - K - F - K - E (配列番号：102)、及び

L - K - A - F - Y - E - K - V - F - E - K - F - K - E (配列番号：103)

からなる群より独立して選ばれる1以上のアミノ酸配列を含む、アテローム性動脈硬化症の1以上の症状を改善するペプチド。

【請求項2】

少なくとも10アミノ酸長である、請求項1記載のペプチド。

【請求項3】

約40以下のアミノ酸長である、請求項2記載のペプチド。

【請求項4】

全てのアミノ酸が、「L」アミノ酸である、請求項1記載のペプチド。

【請求項5】

少なくとも一つの「D」アミノ酸を含む、請求項1記載のペプチド。

【請求項6】

複数の「D」アミノ酸を含む、請求項1記載のペプチド。

【請求項7】

鏡像異性アミノ酸の少なくとも半数が、「D」アミノ酸である、請求項1記載のペプチド。

【請求項8】

鏡像異性アミノ酸の全てが、「D」アミノ酸である、請求項1記載のペプチド。

【請求項9】

アミノ酸及び/又はカルボキシル末端に結合された保護基を更に含む、請求項1記載のペプチド。

【請求項10】

前記保護基が、アセチル(Ac)、アミド、3~20の炭素原子のアルキル基、Fmoc、t-ブトキシカルボニル(Tboc)、9-フルオレンアセチル基、1-フルオレンカルボン酸基、9-フルオレンカルボン酸基、9-フルオレノン-1-カルボン酸基、ベンジルオキシカルボニル、キサンチル(Xan)、トリチル(Trt)、4-メチルトリチル(Mtt)、4-メトキシトリチル(Mmt)、4-メトキシ-2,3,6-トリメチル-ベンゼンスルホニル(Mtr)、メシチレン-2-スルホニル(Mts)、4,4-ジメトキシベンズヒドリル(Mbh)、トシリル(Tos)、2,2,5,7,8-ペンタメチルクロマン-6-スルホニル(Pmc)、4-メチルベンジル(MeBz1)、4-メトキシベンジル(MeOBz1)、ベンジルオキシ(Bz1O)、ベンジル(Bz1)、ベンゾイル(Bz)、3-ニトロ-2-ピリジンスルフェニル(NpyS)、1-(4,4,-ジメチル-2,6-ジオキソシクロヘキシリデン)エチル(Dde)、2,6-ジクロロベンジル(2,6-Dic1-Bz1)、2-クロロベンジルオキシカルボニル(2-C1-Z)、2-ブロモベンジルオキシカルボニル(2-Br-Z)、ベンジルオキシメチル(Bom)、シクロヘキシルオキシ(cHxO)、t-ブトキシメチル(Bum)、t-ブトキシ(tBuO)、t-ブチル(tBu)及びトリフルオロアセチル(TFA)からなる群より選ばれる保護基である、請求項9記載のペプチド。

【請求項11】

アミノ酸末端に結合された第一保護基及びカルボキシル末端に結合された第二保護基を更に含む、請求項1記載のペプチド。

【請求項12】

薬理的に許容される賦形剤と混合される、請求項1記載のペプチド。

【請求項13】

哺乳動物への経口投与に好適な薬理的に許容される賦形剤と混合される、請求項1記載のペプチド。

【請求項14】

アミノ末端に結合された保護基を含み、かつ当該アミノ末端保護基が、ベンゾイル基、

アセチル、プロピオニル、カルボベンゾキシ、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、N - メチル アンスラニリル及び3 ~ 20の炭素原子のアルキルからなる群より選ばれる保護基である、請求項9記載のペプチド。

【請求項15】

カルボキシリ末端に結合された保護基を含み、かつ当該カルボキシリ末端保護基がアミドである、請求項9記載のペプチド。

【請求項16】

ベンゾイル基、アセチル、プロピオニル、カルボベンゾキシ、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、N - メチル アンスラニリル及び3 ~ 20炭素原子のアルキルからなる群より選ばれるアミノ末端に結合された第一保護基；並びに、カルボキシリ末端に結合された第二保護基を更に含み、かつ当該カルボキシリ末端保護基がアミドである、請求項15記載のペプチド。

【請求項17】

薬学的に許容される賦形剤において単位製剤として提供される、請求項1記載のペプチド。

【請求項18】

徐放製剤として提供される、請求項1記載のペプチド。

【請求項19】

哺乳動物におけるアテローム性動脈硬化症の1以上の症状を緩和するための医薬製剤であって、以下：

スタチン；及び

10 ~ 30アミノ酸長の範囲にあり；少なくとも一つのクラスA両親媒性ヘリックスを含み；酸化剤による酸化からリン脂質を保護し；かつ、D - 18 Aペプチドでない、ペプチド又はペプチドのコンカタマーの有効量

を含む、前記製剤。

【請求項20】

前記ペプチドが、請求項1、2及び4 ~ 18のいずれか1項記載のペプチドである、請求項19記載の製剤。

【請求項21】

前記ペプチドが、D - 4 F又はL - 4 Fである、請求項19記載の製剤。

【請求項22】

前記ペプチドが、薬学的に許容される賦形剤中にある、請求項21記載の製剤。

【請求項23】

前記ペプチドが、経口投与に好適な薬学的に許容される賦形剤中にある、請求項21記載の製剤。

【請求項24】

単位投薬製剤である、請求項21記載の製剤。

【請求項25】

経口投与、鼻腔内投与、直腸投与、腹腔内注射、静脈内注射、皮下注射、経皮的投与及び筋肉内注射からなる群より選ばれる経路によって投与するためには好適である、請求項21記載の製剤。

【請求項26】

前記スタチンが、セリバスタチン、アトルバスタチン、シムバスタチン、プラバスタチン、フラバスタチン、ロバスタチン、ロスバスタチン及びピタバスタチンからなる群より選ばれる、請求項21記載の製剤。

【請求項27】

前記ペプチドの有効量が、スタチンなしに投与された前記ペプチドの有効量よりも低い、請求項21記載の製剤。

【請求項28】

前記スタチン及び/又は前記ペプチドが、徐放製剤中にある、請求項21記載の製剤。

**【請求項 29】**

前記ペプチドが、配列番号5(F4)のアミノ酸配列を含む、請求項2\_1記載の製剤。

**【請求項 30】**

1以上のリン脂質を更に含む、請求項2\_1記載の製剤。

**【請求項 31】**

請求項1～18のいずれか1項記載のペプチドを含む、骨粗鬆症又はアテローム性動脈硬化症の治療のための医薬製剤。