

【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5年5月29日(2023.5.29)

【公開番号】特開2023-10979(P2023-10979A)

【公開日】令和5年1月20日(2023.1.20)

【年通号数】公開公報(特許)2023-012

【出願番号】特願2022-187561(P2022-187561)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/08(2019.01)

A 6 1 K 38/10(2006.01)

A 6 1 P 29/00(2006.01)

A 6 1 P 39/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

C 0 7 K 7/06(2006.01)

C 0 7 K 7/08(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 38/08

A 6 1 K 38/10

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 39/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 K 7/06 Z N A

C 0 7 K 7/08

【手続補正書】

【提出日】令和5年5月19日(2023.5.19)

【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】

炎症を治療するための医薬組成物であって、NFカッパBの活性を阻害する6～20アミノ酸残基の長さの1つ以上のペプチドを治療有効量で含み、

ここで前記1つ以上のペプチドが、

コア配列(8): X x x - A l a - D - G l u - A s n、

コア配列(4): X x x - A l a - D - G l u - A l a、又は

コア配列(6): X x x - A l a - D - A s n - A l a

(式中、X x xは、M e t、I l e、V a l、C y s、T r p、T y r、P h e、5-メチル-T r p、アロ-I l e、β-スチリル-A l a、ナフチル-A l a、ジフェニル-A l a、α-アミノ酪酸、α-アミノカプロン酸、ノルロイシン、α-アミノ-2-フェニル酪酸、α-アミノ-1-ナフタレンプロパン酸、β-シクロヘキシル-A l a、デヒドロアラニン、及びβ-tert-ブチル-A l aからなる群から選択される)

からなる群から選択され、但し配列番号041～113を含むペプチドを除外する、医薬組成物。

【請求項2】

前記1つ以上のペプチドが以下:

コア配列(8)、コア配列(8-N)、コア配列(8-U)、グループ(8-S)、グル

10

20

30

40

50

ープ（８－Ｔ）、グループ（８－Ｖ）、コア配列（４）、コア配列（４－Ｎ）、コア配列（４－Ｕ）、グループ（４－Ｓ）、グループ（４－Ｔ）、グループ（４－Ｖ）、コア配列（６）、コア配列（６－Ｎ）、コア配列（６－Ｕ）、グループ（６－Ｓ）、グループ（６－Ｔ）、グループ（６－Ｖ）、NVA [D] ENA（配列番号１１４）、ANVA [D] ENA（配列番号１１５）、Sar-WA [D] EA-Sar（配列番号０１９）、AWA [D] EAK（配列番号０２１）、LIA [D] EAK（配列番号０５３）及びAWA [D] NAK（配列番号０２３）

のペプチドからなる群から選択される、請求項１に記載の医薬組成物。

【請求項３】

前記１つ以上のペプチドが、以下：

コア配列（８）：Xxx-Ala-D-Glu-Asn

（式中、Xxxは、Met、Ile、Val、Cys、Trp、Tyr、Phe、５－メチル－Trp、アロ－Ile、β－スチリル－Ala、ナフチル－Ala、ジフェニル－Ala、α－アミノ酪酸、α－アミノカプロン酸、ノルロイシン、α－アミノ－２－フェニル酪酸、α－アミノ－１－ナフタレンプロパン酸、β－シクロヘキシル－Ala、デヒドロアラニン、及びβ－tert－ブチル－Alaからなる群から選択される）；

コア配列（８－Ｎ）：Xxx-Ala-D-Glu-Asn

（式中、Xxxは、Met、Ile、Val、Cys、Trp、Tyr、又はPheからなる群から選択される）；

コア配列（８－Ｕ）：Xxx-Ala-D-Glu-Asn

（式中、Xxxは、５－メチル－Trp、アロ－Ile、β－スチリル－Ala、ナフチル－Ala、ジフェニル－Ala、α－アミノ酪酸、α－アミノカプロン酸、ノルロイシン、α－アミノ－２－フェニル酪酸、α－アミノ－１－ナフタレンプロパン酸、β－シクロヘキシル－Ala、デヒドロアラニン、及びβ－tert－ブチル－Alaからなる群から選択される）；

グループ（８－Ｔ）：NVA [D] ENA（配列番号１１４）及びANVA [D] ENA（配列番号１１５）からなる群から選択される配列を有する長さ２０アミノ酸残基以下のペプチドからなるグループ；又は

グループ（８－Ｖ）：NVA [D] ENA（配列番号１１４）及びANVA [D] ENA（配列番号１１５）のペプチドからなる群から選択される配列を有するペプチドからなるグループ；

のペプチドからなる群から選択される、請求項１に記載の医薬組成物。

【請求項４】

前記XxxがMetである、請求項３に記載の医薬組成物。

【請求項５】

前記１つ以上のペプチドが、配列NVA [D] ENA（配列番号１１４）又はANVA [D] ENA（配列番号１１５）を含む長さ１２アミノ酸残基以下のペプチドの群から選択される、請求項３に記載の医薬組成物。

【請求項６】

前記１つ以上のペプチドが、配列NVA [D] ENA（配列番号１１４）又はANVA [D] ENA（配列番号１１５）を含む長さ８アミノ酸残基以下のペプチドの群から選択される、請求項３に記載の医薬組成物。

【請求項７】

前記１つ以上のペプチドが、非天然のアミノ酸、及び非タンパク性アミノ酸からなる群から選択される少なくとも１つのアミノ酸を含む、請求項５に記載の医薬組成物。

【請求項８】

前記医薬組成物が、医薬的に許容し得る担体をさらに含む、請求項１～７のいずれか１項に記載の医薬組成物。

【請求項９】

前記医薬組成物が、患部への又はその近傍への局所適用、患部への又はその近傍への皮下

10

20

30

40

50

投与、又は静脈内投与により投与される、請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

疼痛を治療するための医薬組成物であって、以下：

コア配列 (8) : $Xxx-A\text{la}-D-Glu-Asn$ 、

コア配列 (4) : $Xxx-A\text{la}-D-Glu-Ala$ 、又は

コア配列 (6) : $Xxx-A\text{la}-D-Asn-Ala$

(式中、 Xxx は、 Met 、 Ile 、 Val 、 Cys 、 Trp 、 Tyr 、 Phe 、5-メチル- Trp 、アロ- Ile 、 β -スチリル- Ala 、ナフチル- Ala 、ジフェニル- Ala 、 α -アミノ酪酸、 α -アミノカプロン酸、ノルロイシン、 α -アミノ-2-フェニル酪酸、 α -アミノ-1-ナフタレンプロパン酸、 β -シクロヘキシル- Ala 、デヒドロアラニン、及び β -tert-ブチル- Ala からなる群から選択される)

を含むペプチドからなる群から選択され、但し配列番号 041～113 を含むペプチドを除外する、6～20 アミノ酸残基の長さの 1 つ以上のペプチドを治療有効量で含む、医薬組成物。

10

【請求項 11】

前記 1 つ以上のペプチドが以下：

コア配列 (8)、コア配列 (8-N)、コア配列 (8-U)、グループ (8-S)、グループ (8-T)、グループ (8-V)、コア配列 (4)、コア配列 (4-N)、コア配列 (4-U)、グループ (4-S)、グループ (4-T)、グループ (4-V)、コア配列 (6)、コア配列 (6-N)、コア配列 (6-U)、グループ (6-S)、グループ (6-T)、グループ (6-V)、 $NVA[D]ENA$ (配列番号 114)、 $ANVA[D]ENA$ (配列番号 115)、 $Sar-WA[D]EA-Sar$ (配列番号 019)、 $AWA[D]EAK$ (配列番号 021)、 $LIA[D]EAK$ (配列番号 053) 及び $AWA[D]NAK$ (配列番号 023)

のペプチドからなる群から選択される、請求項 10 に記載の医薬組成物。

20

【請求項 12】

前記医薬組成物が、医薬的に許容し得る担体をさらに含む、請求項 10 又は 11 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記医薬組成物が、患部への又はその近傍への局所適用、患部への又はその近傍への皮下投与、又は静脈内投与により投与される、請求項 10～12 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

30

【請求項 14】

放射線曝露の後遺症を治療するための医薬組成物であって、以下：

コア配列 (8) : $Xxx-A\text{la}-D-Glu-Asn$ 、

コア配列 (4) : $Xxx-A\text{la}-D-Glu-Ala$ 、又は

コア配列 (6) : $Xxx-A\text{la}-D-Asn-Ala$

(式中、 Xxx は、 Met 、 Ile 、 Val 、 Cys 、 Trp 、 Tyr 、 Phe 、5-メチル- Trp 、アロ- Ile 、 β -スチリル- Ala 、ナフチル- Ala 、ジフェニル- Ala 、 α -アミノ酪酸、 α -アミノカプロン酸、ノルロイシン、 α -アミノ-2-フェニル酪酸、 α -アミノ-1-ナフタレンプロパン酸、 β -シクロヘキシル- Ala 、デヒドロアラニン、及び β -tert-ブチル- Ala からなる群から選択される)

を含むペプチドからなる群から選択され、但し配列番号 041～113 を含むペプチドを除外する、6～20 アミノ酸残基の長さの 1 つ以上のペプチドを治療有効量で含む、医薬組成物。

40

【請求項 15】

前記 1 つ以上のペプチドが以下：

コア配列 (8)、コア配列 (8-N)、コア配列 (8-U)、グループ (8-S)、グループ (8-T)、グループ (8-V)、コア配列 (4)、コア配列 (4-N)、コア配列

50

(4-U)、グループ(4-S)、グループ(4-T)、グループ(4-V)、コア配列(6)、コア配列(6-N)、コア配列(6-U)、グループ(6-S)、グループ(6-T)、グループ(6-V)、NVA[D]ENA(配列番号114)、ANVA[D]ENA(配列番号115)、Sar-WA[D]EA-Sar(配列番号019)、AWA[D]EAK(配列番号021)、LIA[D]EAK(配列番号053)及びAWA[D]NAK(配列番号023)

のペプチドからなる群から選択される、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項16】

前記医薬組成物が、医薬的に許容し得る担体をさらに含む、請求項14又は15のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項17】

前記医薬組成物が、患部への又はその近傍への局所適用、患部への又はその近傍への皮下投与、又は静脈内投与により投与される、請求項14～16のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項18】

前記放射線曝露の後遺症が粘膜炎である、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項19】

前記放射線被曝の後遺症が粘膜炎を除外する、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項20】

細胞、組織、又は臓器中のNFκB活性化を阻害するか又はNFκB活性を阻害するための剤であって、以下：

コア配列(8)：Xxx-Ala-D-Glu-Asn、

コア配列(4)：Xxx-Ala-D-Glu-Ala、又は

コア配列(6)：Xxx-Ala-D-Asn-Ala

コア配列(8)、コア配列(8-N)、コア配列(8-U)、グループ(8-S)、グループ(8-T)、グループ(8-V)、コア配列(4)、コア配列(4-N)、コア配列(4-U)、グループ(4-S)、グループ(4-T)、グループ(4-V)、コア配列(6)、コア配列(6-N)、コア配列(6-U)、グループ(6-S)、グループ(6-T)、グループ(6-V)、NVA[D]ENA(配列番号114)、ANVA[D]ENA(配列番号115)、Sar-WA[D]EA-Sar(配列番号019)、AWA[D]EAK(配列番号021)、LIA[D]EAK(配列番号053)及びAWA[D]NAK(配列番号023)

(式中、Xxxは、Met、Ile、Val、Cys、Trp、Tyr、Phe、5-メチル-Trp、アロ-Ile、β-スチリル-Ala、ナフチル-Ala、ジフェニル-Ala、α-アミノ酪酸、α-アミノカプロン酸、ノルロイシン、α-アミノ-2-フェニル酪酸、α-アミノ-1-ナフタレンプロパン酸、β-シクロヘキシル-Ala、デヒドロアラニン、及びβ-tert-ブチル-Alaからなる群から選択される)

を含むペプチドからなる群から選択され、但し配列番号041～113を含むペプチドを除外する、6～20アミノ酸残基の長さの1つ以上のペプチドを治療有効量で含む、剤。

【請求項21】

細胞、組織、又は臓器中のsmad2のリン酸化を上昇させるための剤であって、以下：

コア配列(8)：Xxx-Ala-D-Glu-Asn、

コア配列(4)：Xxx-Ala-D-Glu-Ala、又は

コア配列(6)：Xxx-Ala-D-Asn-Ala

コア配列(8)、コア配列(8-N)、コア配列(8-U)、グループ(8-S)、グループ(8-T)、グループ(8-V)、コア配列(4)、コア配列(4-N)、コア配列(4-U)、グループ(4-S)、グループ(4-T)、グループ(4-V)、コア配列(6)、コア配列(6-N)、コア配列(6-U)、グループ(6-S)、グループ(6-T)、グループ(6-V)、NVA[D]ENA(配列番号114)、ANVA[D]ENA(配列番号115)、Sar-WA[D]EA-Sar(配列番号019)、AW

10

20

30

40

50

A [D] E A K (配列番号 0 2 1)、L I A [D] E A K (配列番号 0 5 3) 及び A W A [D] N A K (配列番号 0 2 3)

(式中、X x x は、M e t、I l e、V a l、C y s、T r p、T y r、P h e、5-メチル-T r p、アロ-I l e、 β -スチリル-A l a、ナフチル-A l a、ジフェニル-A l a、 α -アミノ酪酸、 α -アミノカプロン酸、ノルロイシン、 α -アミノ-2-フェニル酪酸、 α -アミノ-1-ナフタレンプロパン酸、 β -シクロヘキシル-A l a、デヒドロアラニン、及び β -t e r t -ブチル-A l a からなる群から選択される)

を含むペプチドからなる群から選択され、但し配列番号 0 4 1 ~ 1 1 3 を含むペプチドを除外する、6 ~ 2 0 アミノ酸残基の長さの 1 つ以上のペプチドを治療有効量で含む、剤。

【請求項 2 2】

前記炎症が感染に関連するものである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の炎症を治療するための医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記炎症がウイルス感染に関連するものである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の炎症を治療するための医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記炎症が成人呼吸窮迫症候群に関連するものである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の炎症を治療するための医薬組成物。

【請求項 2 5】

前記炎症が心疾患に関連するものである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の炎症を治療するための医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記炎症が血管炎に関連するものである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の炎症を治療するための医薬組成物。

10

20

30

40

50