

【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25年7月25日 (2013.7.25)

【公表番号】特表2012-528887(P2012-528887A)

【公表日】平成24年11月15日 (2012.11.15)

【年通号数】公開・登録公報2012-048

【出願番号】特願2012-514171(P2012-514171)

【国際特許分類】

C 0 7 K 14/47 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 L 27/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 5/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 K 35/12 (2006.01)

C 0 7 K 7/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 14/47 Z N A

A 6 1 K 37/02

A 6 1 L 27/00 F

A 6 1 L 27/00 V

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 5/10

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 43/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 L 27/00 Y

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 35/12

C 0 7 K 7/04

【手続補正書】

【提出日】平成25年6月3日 (2013.6.3)

【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】

アミノ酸配列 K H H L G L E E P K K L R を有するペプチド、アミノ酸配列 K H H L G L E E P K K を有するペプチド、アミノ酸配列 H L G L E E P K K L R を有するペプチド、それらのいずれかの類似体、それらのいずれかのプロドラッグ、またはそれらのいずれかの薬学的に許容される塩を含む化合物。

【請求項 2】

式 I :

$$X - Y - R^1 R^2 R^3 R^4 R^5 R^6 R^7 R^8 R^9 R^{10} R^{11} R^{12} R^{13} - Y' - X' \quad (I)$$

の化合物

(式中、

X は、存在し、または存在せず、存在する場合、キャッピング基、ポリアルキレンオキシド、または 2 個～6 個または 10 個のさらなる任意のタイプのアミノ酸からなるペプチドであり、前記ペプチドは、任意選択的に、キャッピング基またはポリアルキレンオキシドによって終結しており、

Y は、存在し、または存在せず、存在する場合、連結基であり、

R^1 は、存在し、または存在せず、存在する場合、(pH 6.0 において) プラスに荷電したアミノ酸であり、

R^2 は、存在し、または存在せず、存在する場合、(pH 6.0 において) プラスに荷電したアミノ酸であり、

R^3 は、任意のアミノ酸であり、

R^4 は、任意のアミノ酸であり、

R^5 は、任意のアミノ酸であり、

R^6 は、任意のアミノ酸であり、

R^7 は、任意のアミノ酸であり、

R^8 は、任意のアミノ酸であり、

R^9 は、任意のアミノ酸であり、

R^{10} は、(pH 6.0 において) プラスに荷電したアミノ酸であり、

R^{11} は、(pH 6.0 において) プラスに荷電したアミノ酸であり、

R^{12} は、存在し、または存在せず、存在する場合、任意のアミノ酸であり、

R^{13} は、存在し、または存在せず、存在する場合、(pH 6.0 において) プラスに荷電したアミノ酸であり、

Y' は、存在し、または存在せず、存在する場合、連結基であり、

X' は、存在し、または存在せず、存在する場合、キャッピング基、ポリアルキレンオキシド、または 2 個～6 個または 10 個のさらなるアミノ酸からなるペプチドであり、このペプチドは、任意選択的に、キャッピング基またはポリアルキレンオキシドによって終結している)

またはそれらの薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

R^1 が、存在する場合、K、R および H からなる群から選択されるアミノ酸であり、

R^2 が、存在する場合、K、R および H からなる群から選択されるアミノ酸であり、

R^3 が、(pH 6.0 において) プラスに荷電したアミノ酸であり、

R^4 が、非極性側鎖を有するアミノ酸であり、

R^5 が、G であり、

R^6 が、非極性側鎖を有するアミノ酸であり、

R^7 が、E および N からなる群から選択されるアミノ酸であり、

R⁸ が、E および N からなる群から選択されるアミノ酸であり、
R⁹ が、P であり、
R¹⁰ が、K、R および H からなる群から選択されるアミノ酸であり、
R¹¹ が、K、R および H からなる群から選択されるアミノ酸であり、
R¹² が、存在する場合、非極性側鎖を有するアミノ酸であり、および / または
R¹³ が、存在する場合、K、R および H からなる群から選択されるアミノ酸である、
のいずれかの組み合わせである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

薬学的に許容される担体と組み合わせた、請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む組成物。

【請求項 5】

前記担体が液体担体である、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記担体が、生体医用インプラントである、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 7】

骨再吸収阻害剤および体重管理薬からなる群から選択される少なくとも 1 つの追加の活性薬剤をさらに含む、請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 8】

対象において、骨形成を増強し、同時に骨再吸収を阻害するための医薬組成物であって、前記対象において骨形成を増強し、同時に骨再吸収を阻害するのに有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 9】

障害のある骨状態を有する対象において骨の沈着および成熟を誘導するための医薬組成物であって、前記対象において骨の沈着および成熟を誘導するのに有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 10】

前記障害のある骨状態が、前記対象の標的化された部位にある、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記標的化された部位が、椎間腔、椎間関節、骨折部位、口の骨、顎先の骨、顎の骨、インプラント部位およびそれらのいずれかの組合せ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。

【請求項 12】

髄腔内投与、皮下投与、皮膚投与、経口投与、静脈内投与、腹腔内投与、筋肉内投与、インプラントを介した投与、マトリックスを介した投与、ゲルを介した投与、およびそれらのいずれかの組合せからなる群から選択される方法により投与される、請求項 8 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記状態が、骨折、骨欠損、骨移植、骨移植片、骨がん、関節置換、関節修復、癒合、小関節面修復、骨変性、歯科インプラント、歯の修復、骨髄欠陥およびそれらのいずれかの組合せからなる群から選択される、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記骨欠損が、骨における間隙、変形または癒着不能骨折である、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記骨変性が、骨減少症または骨粗鬆症によるものである、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記骨欠損が、小人症によるものである、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記関節置換が、脊椎関節、膝関節、股関節、足根関節、指節骨関節、肘関節、肩関節、足首関節、手関節、仙腸関節およびそれらのいずれかの組合せからなる群から選択される関節のものである、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記関節修復が、脊椎関節、膝関節、股関節、足根関節、指節骨関節、肘関節、肩関節、足首関節、手関節、仙腸関節およびそれらのいずれかの組合せからなる群から選択される関節のものである、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

骨再吸収阻害剤を前記対象に有効量において投与するステップをさらに含む、請求項 13 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

対象において体重を管理するための医薬組成物であって、体重を管理するのに有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 21】

前記対象における体重の管理が、体重増加の減少または体重減少の誘導である、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記対象における体重の管理が、前記対象の体格指数の減少である、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記対象が、少なくとも約 25 kg/m^2 の体格指数を有する、請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記対象が、少なくとも約 30 kg/m^2 の体格指数を有する、請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

少なくとも約 16 週または約 24 週の期間、継続投与される、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

前記対象が少なくとも 5 % の体重減少を達成するまで、または、前記対象の体格指数が約 25 kg/m^2 未満まで減少するまで継続投与される、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

前記対象における脂肪減少を誘導するのに有効な量において投与される、請求項 20 から 26 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 28】

前記対象における脂肪細胞分化を阻害するのに有効な量において投与される請求項 20 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

体重管理薬をさらに含む、請求項 20 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

前記体重管理薬が、食欲抑制薬、リパーゼ阻害剤、抗鬱薬、抗痙攣薬およびそれらのいずれかの組合せからなる群から選択される、請求項 29 に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

対象において骨髓再構成を改善するための医薬組成物であって、骨髓再構成を改善するのに有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 32】

幹細胞をエキスピボで増殖させる方法であって、請求項 1 または 2 に記載の化合物を対象由来の幹細胞と接触させるステップを含み、前記幹細胞が、対象中に再導入可能な条件下で維持される方法。

【請求項 3 3】

前記対象が、化学療法を受けているまたは受けた対象、放射線を受けているまたは受けた対象、再生不良性貧血を有する対象、骨髄異形成を有する対象、およびそれらの任意の組合せからなる群から選択される、請求項 3 1 または 3 2 に記載の方法。

【請求項 3 4】

請求項 8 ～ 3 3 のいずれか 1 項に記載の方法を実行するための医薬の調製における、請求項 1 または 2 に記載の化合物の使用。

【請求項 3 5】

請求項 8 ～ 3 3 のいずれか 1 項に記載の方法を実行するための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の使用。