

【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29年11月9日 (2017.11.9)

【公表番号】特表2017-501967(P2017-501967A)

【公表日】平成29年1月19日 (2017.1.19)

【年通号数】公開・登録公報2017-003

【出願番号】特願2016-521985(P2016-521985)

【国際特許分類】

C 0 7 K 7/00 (2006.01)

C 0 7 K 14/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/02 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 7/00 Z N A

C 0 7 K 14/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/02

A 6 1 K 9/70 4 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成29年9月27日 (2017.9.27)

【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】

式 I :

A l a <sup>1</sup> - X a a <sup>2</sup> - X a a <sup>3</sup> - S e r <sup>4</sup> - X a a <sup>5</sup> - X a a <sup>6</sup> - C y s <sup>7</sup> ( 配列番号 1 )

( 式中、

Xaa<sup>2</sup>は、Arg、Lys、Ala、Cit（シトルリン）、Orn（オルニチン）、アセチル化Ser、Sar、D-ArgおよびD-Lysから選択され；

Xaa<sup>3</sup>は、Val、Ala、Leu、Nle、Ile、Gly、Lys、Pro、Aib（2-アミノイソ酪酸）、Acpc（1-アミノシクロペンタンカルボン酸）およびTyrから選択され；

Xaa<sup>5</sup>は、Ile、Ala、Leu、norLeu、ValおよびGlyから選択され；そして

Xaa<sup>6</sup>は、His、Argおよび6-NH<sub>2</sub>-Phe（6-アミノフェニルアラニン）から選択される）のアミノ酸配列を含む、ペプチド。

【請求項2】

7～25個（7個および25個を含めて）のアミノ酸を含有する、請求項1に記載のペプチド。

【請求項3】

プロテアーゼ耐性、血清安定性および/またはバイオアベイラビリティを増加させるための1つまたはそれを超える化学修飾を含む、請求項1に記載のペプチド。

【請求項4】

請求項1に記載のペプチドと、薬学的に許容され得る担体とを含む、医薬組成物。

【請求項5】

経口投与、筋肉内投与、静脈内投与、皮下投与、局所投与、経皮投与、直腸投与、膣投与、肺投与、鼻腔内投与、口腔内投与または舌下投与のために製剤化されている、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項6】

ポリマー担体、崩壊剤、潤滑剤、溶媒または膨潤剤から選択される1つまたはそれを超える薬理学的に許容され得る賦形剤をさらに含む、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項7】

錠剤、丸剤、カプセル、顆粒剤、シロップ、スプレー、エアロゾル、リボソーム組成物、軟膏、坐剤、インプラント、プラスターまたは徐放製剤として製剤化されている、請求項4～6のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項8】

疾患、症状または障害を処置するための、請求項1～3のいずれか一項に記載のペプチドを含む医薬組成物または請求項4～7のいずれか一項に記載の医薬組成物であって、それを必要とする被験体に投与されることを特徴とする、医薬組成物。

【請求項9】

アミノ酸配列Ala<sup>1</sup>-Arg<sup>2</sup>-Val<sup>3</sup>-Ser<sup>4</sup>-Ile<sup>5</sup>-His<sup>6</sup>-Cys<sup>7</sup>（配列番号18）を含む、ペプチド。

【請求項10】

プロテアーゼ耐性、血清安定性および/またはバイオアベイラビリティを増加させるための1つまたはそれを超える化学修飾を含む、請求項9に記載のペプチド。

【請求項11】

請求項9に記載のペプチドと、薬学的に許容され得る担体とを含む、医薬組成物。

【請求項12】

経口投与、筋肉内投与、静脈内投与、皮下投与、局所投与、経皮投与、直腸投与、膣投与、肺投与、鼻腔内投与、口腔内投与または舌下投与のために製剤化されている、請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項13】

ポリマー担体、崩壊剤、潤滑剤、溶媒または膨潤剤から選択される1つまたはそれを超える薬理学的に許容され得る賦形剤をさらに含む、請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項14】

錠剤、丸剤、カプセル、顆粒剤、シロップ、スプレー、エアロゾル、リボソーム組成物、軟膏、坐剤、インプラント、プラスターまたは徐放製剤として製剤化されている、請求

項 1 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

疾患、症状または障害を処置するための、請求項 9 または 1 0 に記載のペプチドを含む医薬組成物または請求項 1 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物であって、それを必要とする被験体に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 1 6】

ヒトの処置のための、ペプチド A l a <sup>1</sup> - A r g <sup>2</sup> - V a l <sup>3</sup> - S e r <sup>4</sup> - I l e <sup>5</sup> - H i s <sup>6</sup> - C y s <sup>7</sup> (配列番号 1 8) を含む組成物。

【請求項 1 7】

前記疾患、症状または障害が脳卒中である、請求項 1 5 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】0 0 1 0

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 0】

本発明の他の特徴、目的および利点は、以下の詳細な説明において明らかである。しかしながら、詳細な説明は、本発明の実施形態を示すが、限定ではなく単なる例示として示されることを理解すべきである。当業者であれば、詳細な説明から、本発明の範囲内の様々な変更および修正が明らかであろう。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 I :

A l a <sup>1</sup> - X a a <sup>2</sup> - X a a <sup>3</sup> - S e r <sup>4</sup> - X a a <sup>5</sup> - X a a <sup>6</sup> - C y s <sup>7</sup> (配列番号 1 )

(式中、

X a a <sup>2</sup> は、A r g、L y s、A l a、C i t (シトルリン)、O r n (オルニチン)、アセチル化 S e r、S a r、D - A r g および D - L y s から選択され；

X a a <sup>3</sup> は、V a l、A l a、L e u、N l e、I l e、G l y、L y s、P r o、A i b (2 - アミノイソ酪酸)、A c p c (1 - アミノシクロペンタンカルボン酸) および T y r から選択され；

X a a <sup>5</sup> は、I l e、A l a、L e u、n o r L e u、V a l および G l y から選択され；そして

X a a <sup>6</sup> は、H i s、A r g および 6 - N H 2 - P h e (6 - アミノフェニルアラニン) から選択される) のアミノ酸配列を含む、ペプチド。

(項目 2)

7 ~ 2 5 個 (7 個および 2 5 個を含めて) のアミノ酸を含有する、項目 1 に記載のペプチド。

(項目 3)

プロテアーゼ耐性、血清安定性および / またはバイオアベイラビリティを増加させるための 1 つまたはそれを超える化学修飾を含む、項目 1 に記載のペプチド。

(項目 4)

項目 1 に記載のペプチドと、薬学的に許容され得る担体とを含む、医薬組成物。

(項目 5)

経口投与、筋肉内投与、静脈内投与、皮下投与、局所投与、経皮投与、直腸投与、膣投与、肺投与、鼻腔内投与、口腔内投与または舌下投与のために製剤化されている、項目 4 に記載の医薬組成物。

(項目 6)

ポリマー担体、崩壊剤、潤滑剤、溶媒または膨潤剤から選択される 1 つまたはそれを超

える薬理学的に許容され得る賦形剤をさらに含む、項目 4 に記載の医薬組成物。

(項目 7)

錠剤、丸剤、カプセル、顆粒剤、シロップ、スプレー、エアロゾル、リボソーム組成物、軟膏、坐剤、インプラント、プラスターまたは徐放製剤として製剤化されている、項目 4 ～ 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 8)

疾患、症状または障害を処置する方法であって、項目 1 ～ 7 のいずれか一項に記載のペプチドまたは組成物を、それを必要とする被験体に投与することを含む、方法。

(項目 9)

アミノ酸配列  $\text{Ala}^1 - \text{Arg}^2 - \text{Val}^3 - \text{Ser}^4 - \text{Ile}^5 - \text{His}^6 - \text{Cys}^7$  (配列番号 18) を含む、ペプチド。

(項目 10)

プロテアーゼ耐性、血清安定性および/またはバイオアベイラビリティを増加させるための 1 つまたはそれを超える化学修飾を含む、項目 9 に記載のペプチド。

(項目 11)

項目 9 に記載のペプチドと、薬学的に許容され得る担体とを含む、医薬組成物。

(項目 12)

経口投与、筋肉内投与、静脈内投与、皮下投与、局所投与、経皮投与、直腸投与、膣投与、肺投与、鼻腔内投与、口腔内投与または舌下投与のために製剤化されている、項目 11 に記載の医薬組成物。

(項目 13)

ポリマー担体、崩壊剤、潤滑剤、溶媒または膨潤剤から選択される 1 つまたはそれを超える薬理学的に許容され得る賦形剤をさらに含む、項目 11 に記載の医薬組成物。

(項目 14)

錠剤、丸剤、カプセル、顆粒剤、シロップ、スプレー、エアロゾル、リボソーム組成物、軟膏、坐剤、インプラント、プラスターまたは徐放製剤として製剤化されている、項目 11 ～ 13 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 15)

疾患、症状または障害を処置する方法であって、項目 9 ～ 14 のいずれか一項に記載のペプチドまたは組成物を、それを必要とする被験体に投与することを含む、方法。

(項目 16)

ヒトの処置における、ペプチド  $\text{Ala}^1 - \text{Arg}^2 - \text{Val}^3 - \text{Ser}^4 - \text{Ile}^5 - \text{His}^6 - \text{Cys}^7$  (配列番号 18) の使用。

(項目 17)

前記疾患、症状または障害が脳卒中である、項目 15 に記載の方法。

(項目 18)

前記ペプチドまたは組成物が、アミノ酸配列  $\text{Ala}^1 - \text{Arg}^2 - \text{Val}^3 - \text{Ser}^4 - \text{Ile}^5 - \text{His}^6 - \text{Cys}^7$  (配列番号 18) を有するペプチドを含む、項目 17 に記載の方法。