

【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 1 a ¹ - X a a ² - X a a ³ - S e r ⁴ - X a a ⁵ - X a a ⁶ - C y s ⁷ (配列番号1)
)
(式中、

Xaa²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；

Xaa³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；

Xaa⁵は、Ile、Ala、Leu、norLeu、ValおよびGlyから選択され；そして

Xaa⁶は、His、Argおよび6-NH₂-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、腔投与、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、リポソーム組成物、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 Ala¹-Arg²-Val³-Ser⁴-Ile⁵-His⁶-Cys⁷(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、腔投与、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、リポソーム組成物、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11～13のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項15】

疾患、症状または障害を処置するための、請求項9または10に記載のペプチドを含む医薬組成物または請求項11～14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16】

ヒトの処置のための、ペプチドAla¹-Arg²-Val³-Ser⁴-Ile⁵-His⁶-Cys⁷（配列番号18）を含む組成物。

【請求項17】

前記疾患、症状または障害が脳卒中である、請求項15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】0010

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0010】

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：

Ala¹-Xaa²-Xaa³-Ser⁴-Xaa⁵-Xaa⁶-Cys⁷（配列番号1）

（式中、

Xaa²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；

Xaa³は、Val、Ala、Leu、Nle、Ile、Gly、Lys、Pro、Ab（2-アミノイソ酪酸）、Acpc（1-アミノシクロヘキサンカルボン酸）およびTrpから選択され；

Xaa⁵は、Ile、Ala、Leu、norLeu、ValおよびGlyから選択され；そして

Xaa⁶は、His、Argおよび6-NH₂-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。

（項目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、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、腹投与、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、リポソーム組成物、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 A l a¹ - A r g² - V a l³ - S e r⁴ - I l e⁵ - H i s⁶ - C y s⁷ (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、リポソーム組成物、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 A l a¹ - A r g² - V a l³ - S e r⁴ - I l e⁵ - H i s⁶ - C y s⁷ (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 A l a¹ - A r g² - V a l³ - S e r⁴ - I l e⁵ - H i s⁶ - C y s⁷ (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。