

【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 2 年 7 月 16 日 (2020.7.16)

【公表番号】特表 2019-522046 (P2019-522046A)

【公表日】令和 1 年 8 月 8 日 (2019.8.8)

【年通号数】公開・登録公報 2019-032

【出願番号】特願 2019-517165 (P2019-517165)

【国際特許分類】

C 0 7 K 14/00 (2006.01)

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

C 0 7 K 19/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/10 (2006.01)

A 6 1 K 38/16 (2006.01)

A 6 1 K 38/08 (2019.01)

A 6 1 K 31/728 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 K 38/18 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 1 2 N 15/62 (2006.01)

C 1 2 N 15/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 14/00 Z N A

C 0 7 K 7/06

C 0 7 K 19/00

A 6 1 K 38/10

A 6 1 K 38/16

A 6 1 K 38/08

A 6 1 K 31/728

A 6 1 P 19/02

A 6 1 K 38/18

A 6 1 P 43/00 1 0 7

C 1 2 N 15/62 Z

C 1 2 N 15/18

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 6 月 5 日 (2020.6.5)

【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】

対象の変形性関節症の治療に使用するための医薬組成物であって、前記医薬組成物は、
配列番号 1 に記載されるアミノ酸配列、またはそのフラグメントもしくは変異体、を含む
少なくとも 1 種のペプチドを含み、配列番号 1 が：

X₁ - T y r - X₂ - L e u - X₃ - A l a - G l y - X₄ - L y s - A s n - P h e
- P h e - X₅ (配列番号 1)

であり、式中、

X_1 は、空であるか、バリンであるか、または

$Z_1 - Val$

$Asp - Z_1 - Val$

$Ser - Asp - Z_1 - Val$ (配列番号 5)

$Z_2 - Ser - Asp - Z_1 - Val$ (配列番号 6)、および

$Gly - Z_2 - Ser - Asp - Z_1 - Val$ (配列番号 7)

から選択される配列であり、

Z_1 がアルギニンであり、かつ Z_2 がスレオニンであるか、あるいは Z_1 が $Ser - Asp$ または $Ser - Asn$ であり、かつ Z_2 がアラニンであり、

X_2 は、 $Glu - Lys$ 、 $Glu - Ser$ 、および $Asp - Leu$ から選択される配列であり、

X_3 は、空であるか、リジンであるか、または

$Lys - Asp$

$Lys - Asp - Leu$

$Lys - Asp - Leu - Glu$ (配列番号 8)

$Lys - Asp - Leu - Glu - Glu$ (配列番号 9)

$Lys - Asp - Leu - Glu - Glu - Gly$ (配列番号 10)

$Lys - Asp - Leu - Glu - Glu - Gly - Ile$ (配列番号 11)

$Lys - Asp - Leu - Glu - Glu - Gly - Ile - Gln$ (配列番号 12)

)

$Lys - Asp - Leu - Glu - Glu - Gly - Ile - Gln - Z_3$ (配列番号 13)、および

$Lys - Asp - Leu - Glu - Glu - Gly - Ile - Gln - Z_3 - Leu$ (配列番号 14)

から選択される配列であり、

Z_3 は、アラニンまたはスレオニンであり、

X_4 は、システイン、セリン、チロシン、フェニルアラニン、アスパラギン酸、グルタミン酸、アラニン、およびグリシンから選択されるアミノ酸残基であり、

X_5 は、空であるか、トリプトファン残基であるか、または

$Trp - Lys$

$Trp - Lys - Thr$

$Trp - Lys - Thr - Phe$ (配列番号 15)

$Trp - Lys - Thr - Phe - Thr$ (配列番号 16)

$Trp - Lys - Thr - Phe - Thr - Ser$ (配列番号 17)

$Trp - Lys - Thr - Phe - Thr - Ser - X_6$ (配列番号 18) および

$Trp - Lys - Thr - Phe - Thr - Ser - X_6 - Lys - Gln - Ala$ (配列番号 19)

から選択される配列であり、

X_6 は、システイン、セリン、チロシン、フェニルアラニン、アスパラギン酸、グルタミン酸、アラニン、およびグリシンから選択されるアミノ酸残基である、

医薬組成物。

【請求項 2】

前記少なくとも 1 種のペプチドが、11 ~ 50 個のアミノ酸残基の範囲のアミノ酸配列で構成される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記少なくとも 1 種のペプチドが、20 ~ 30 個のアミノ酸残基の範囲のアミノ酸配列で構成される、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

X_1 が、 $Gly - Z_2 - Ser - Asp - Z_1 - Val$ であり、

X_5 が、 $Trp - Lys - Thr - Phe - Thr - Ser - X_6$ である、

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記少なくとも 1 種のペプチドが、配列番号 2、3、4、または 20：

G l y - A l a - S e r - A s p - S e r - A s p - V a l - T y r - A s p - L e u
- L e u - A l a - G l y - S e r - L y s - A s n - P h e - P h e - T r p - L y s
- T h r - P h e - T h r - S e r - S e r (配列番号 2)

G l y - A l a - S e r - A s p - S e r - A s p - V a l - T y r - A s p - L e u
- L e u - L y s - A l a - G l y - S e r - L y s - A s n - P h e - P h e - T r p
- L y s - T h r - P h e - T h r - S e r - S e r (配列番号 3)

G l y - T h r - S e r - A s p - A r g - V a l - T y r - G l u - L y s - L e u
- A l a - G l y - S e r - L y s - A s n - P h e - P h e - T r p - L y s - T h r
- P h e - T h r - S e r - S e r (配列番号 4)

G l y - A l a - S e r - A s p - S e r - A s n - V a l - T y r - A s p - L e u
- L e u - L y s - A l a - G l y - S e r - L y s - A s n - P h e - P h e - T r p
- L y s - T h r - P h e - T h r - S e r - S e r (配列番号 20)

の配列を含む、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記対象は、K e l l g r e n - L a w r e n c e のグレード (または K - L システム)によるグレード 0、1、2 または 3 の変形性関節症に罹患している、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

治療される関節に関節内注射することにより投与される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記少なくとも 1 種のペプチドが、 $10^{-3} \text{ M} \sim 10^{-7} \text{ M}$ の範囲の最終的な関節内濃度で投与されることになる、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】

1 種以上の薬学的に許容される賦形剤を含む、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】

薬学的単位剤形として提供される、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記薬学的単位剤形が、治療される関節の局所注射のための、使い捨ての、投与前のプレフィルドシリンジである、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

少なくとも 1 種の関節内補充療法剤をさらに含む、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記少なくとも 1 種の関節内補充療法剤がヒアルロン酸である、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記少なくとも 1 種の関節内補充療法剤が、 $0.1\% \sim 10\%$ の範囲の濃度のヒアルロン酸である、請求項 12 または 13 に記載の医薬組成物。