

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2008 年 9 月 25 日 (25.09.2008)

PCT

(10)
WO 2008/114577 A3

(51) 国際f 許分類:

C07K 14/00 (2006.01) A61K 38/17 (2006.01)
A61K 8/64 (2006.01) A61P 31/04 (2006.01)
A61K 38/00 (2006.01)(74) 代理人: 三枝 英二 外 (SAEGUSA, Eiji et al.); 〒
5410045 大阪府大阪市中央区道修町 1 - 7 - 1 北
浜 T N K ビ)レ Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2008/053211

(22) 国際出願日: 2008 年 2 月 25 日 (25.02.2008)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権子一タ:
特願 2007-045490 2007 年 2 月 26 日 (26.02.2007) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 国立大学
法人奈良先端科学技術大学院大学 (NATIONAL UNI-
VERSITY CORPORATION NARA INSTITUTE OF
SCIENCE AND TECHNOLOGY) [JP/JP]; 〒6300192
奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 5 Nara (JP). 株式会
社 P H G (PHG CORPORATION) [JP/JP]; 〒6150821
京都府京都市右京区西京極北裏町 2 7 - 1 5 Kyoto
(JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG,
BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, C 0, CR, CU, CZ, DE,
DK, DM, D 0, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH,
GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM,
KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA,
MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI,
NO, NZ, 0M, PG, PH, PL, PT, R 0, RS, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), -X ーラシ T (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨ ー ロ ッ / i (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, N 0, PL, PT, RO, SE,
SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者: および

(75) 発明者 I 出願人 (米国についてのみ): 谷原 正夫 (TANI-
HARA, Masao) [JP/JP]; 〒6300192 奈良県生駒市高山
町 8 9 1 6 - 5 国立大学法人奈良先端科学技術大学
院大学内 Nara (JP). 井田 慶子 (IDA, Keiko) [JP/JP]; 〒
6300192 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 5 国立大学
法人奈良先端科学技術大学院大学内 Nara (JP).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

— 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部
分、請求に基づき国際事務局から入手可能

(88) 国際調査報告書の公開日: 2008 年 11 月 27 日

(54) Title: ANTIBACTERIAL PEPTIDE

(54) 発明の名称: 抗菌性ペプチド

(57) Abstract: Disclosed is a peptide having high safety and an excellent antibacterial activity or a salt of the peptide. Specifically disclosed is a peptide selected from the following peptides (1) and (2) or a salt of the peptide. (1) A peptide comprising an amino acid sequence represented by the general formula (I). (Pro Hyp Gly)_n-(Lys x Gly)_m-(Pro Hyp Gly)₁-(Lys X Gly)_p]α-(Pro Hyp Gly)₁ (I) [wherein n represents an integer of 1 to 6; m represents an integer of 1 to 4; 1 represents an integer of 0 to 7; p represents an integer of 1 to 4; r represents an integer of 1 to 6; α represents an integer of 1 to 6; and X represents an amino acid residue selected from He, Leu and Hyp, provided that the (m+p) pieces of X's may be the same as or different from each other, n+m+1+p+r = 4 to 15, m+p ≥ 2 when 1=0, and m=1, 1=0 and p=1 when α ≥ 2.] (2) A peptide which comprises an amino acid sequence having the substitution, deletion or addition of 1 to 3 amino acid residues other than Lys, Gly and X in the amino acid sequence represented by the general formula (I), and which has an antibacterial activity.(57) 要約: 安定性が高く、優れた抗菌性活性を有するペプチド又はその塩を提供する。以下 (1) 又は (2) で表されるペプチド又はその塩; (1) 下記一般式 (I) で表されるアミノ酸18からなるペプチド (Pro Hyp Gly)_n-(Lys X Gly)_m-(Pro Hyp Gly)₁-(Lys X Gly)_p]α-(Pro Hyp Gly)₁ (I) (ZZで、式 (I) 中、nは1~6の整数であり、mは1~4の整数であり、1は0~7の整数であり、pは1~4の整数であり、rは1~6の整数であり、αは1~6の整数である。Xは、Leu、Ile、Leu及びHypから選択されるいずれかのアミノ酸残基(であり、m+p+1+r ≥ 2を満たし、α ≥ 2の場合はm=1、1=0、p=1を満たす。) (2) 一般式 (I) で表されるアミノ酸配列において、Lys、Gly及びX以外の1~3個のアミノ酸残基が置換、欠失若しくは付加されたアミノ酸配列からなり、かつ抗菌活性を有するペプチド。

Y O 200 / 114577 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/053211

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07K14/00 (2006.01) i , A61K8/64 (2006.01) i , A61K38/00 (2006.01) i , A61K38/17 (2006.01) i , A61P31/41 (2006.01) i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07K14/00 , A61K8/64 , A61K38/00 , A61K38/17 , A61P31/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA (STN) , REGISTRY (STN) , BIOSIS/WPI (DIALOG) , JSTPlus (JDream2)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2005-060550 A (Masao TANIHARA) , 10 March, 2005 (10.03.05), (Family: none)	1 - 12 , 15- 17
A	JP 2005-206542 A (Masao TANIHARA) , 04 August, 2005 (04.08.05), (Family: none)	1 - 12 , 15- 17
A	JP 2003-321500 A (Centmed Inc.), 11 November, 2003 (11.11.03), (Family: none)	1 - 12 , 15- 17
A	JP 11-215983 A (Agriculture, Forestry and Fisheries Technical Information Society) , 10 August, 1999 (10.08.99), (Family: none)	1 - 12 , 15- 17

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
05 March , 2008 (05.03.08)

Date of mailing of the international search report
02 September, 2008 (02.09.08)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/053211

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2006-045214 A (Juntendo Educational Foundation) , 16 February, 2006 (16.02.06), (Family: none)	1 - 12, 15- 17
A	JP 2000-319300 A (Meiji Milk Products Co., Ltd.) , 21 November, 2000 (21.11.00), (Family: none)	1 - 12, 15- 17
A	JP 11-335396 A (Seikagaku Corp.), 07 December, 1999 (07.12.99), & EP 0955312 B1 & US 6040291 A1	1 - 12, 15- 17
P, A	Masao TANIHARA et al., "Sanju Rasen Kozo o Keisei suru Kokinsei Peptide no Sekkei to Gosei", Dai 127 Proceedings of the Annual Meeting of the Pharmaceutical Society of Japan, 05 March, 2007 (05.03.07), page 79, 28Pl-pm040	1 - 12, 15- 17
P, A	W0 2007/010623 A1 (PHG Corp.), 25 January, 2007 (25.01.07), (Family: none)	1 - 12, 15- 17

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/053211

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 13 - 14
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Claims 13-14 include a method for treatment of the human body.
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drawn in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest
the

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, payment of a protest fee.
- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2008/053211

Claim 1 includes great many peptides comprising a wide variety of amino acid sequences.

However, those peptides which are disclosed in the description in the meaning within PCT Article 5 are limited to an extremely small part of the claimed great many peptides. Therefore, claim 1 is not fully supported in the meaning within PCT Article 6.

Such being the case, the search was made on peptides respectively comprising the amino acid sequences depicted in SEQ ID NO:1 to SEQ ID NO:6 which are specifically disclosed in the description.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

仙tCL C07K14/00(2006.01)1, A61K8/64(2006.01)i, A61K38/00(2006.01)i, A61K38/17(2006.01)1, A61P31/04(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

而tcl C07K14/00, A61K8/64, A6138/00, A6138/17, A61P3104

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国境調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA(STN), REGIS IIIY(STN), BIOSIS/ mg1(DIALOG), JSTPlus(IIIrea2)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー	引用文献名 及 一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP 2005-060550 A (谷原正夫) 2005.03.10 (ファミリーなし)	1-12, 15-17
A	JP 2005-206542 A (谷原正夫) 2005.08.04 (ファミリーなし)	1-12, 15-17
A	JP 2003-321500 A (株式会社セントメッド) 2003.11. は (ファミリーなし)	1-12, 15-17
A	JP 11-215983 A (社団法人農林水産技術情報協会) 1999.08.10 (ファミリーなし)	1-12, 15-17

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国境出願 日前の出願または特許であるが、国際出願 日以後に公表されたもの

「J」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行 日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国境出願 日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「IT」国際出願 日又は優先 月推に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性及び進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「I&J」同一パテントファミリー文献

国境調査を完了した日

05.03.200日

国境調査報告の発送日

02.09.2008

国境調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JIP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

松田 芳子

電話番号 03-3581-1101 内線 3488

4N

3126

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び- 部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	JP 2006-045214 A (学校法人順天堂) 2006. 02. 16 (ファミリーなし)	1-12, 15-17
A	JP 2000-319300 A (明治乳業株式会社) 2000.11.21 (7 アミリーなし)	1-12, 15-17
A	JP 11-335396 A (生化学工業株式会社) 1999.12.07 & EP 0955312 B1 & US 6040291 A1	1-12, 15-17
P A	谷原正夫 他, 三重らせん構造を形成する抗菌性ペプチドの設計と 合成, 日本薬学会第 127 年会要旨集, 2007. 03. 05 ,p.79, 28Pl-p m040	1-12, 15-17
P A	WO 2007/010623 A1 (株式会社 PHG) 2007. 01. 25 (7 アミリーなし)	1-12, 15-17

第II欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

法第8条第3項 (PCTII7条(2)(a))の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. 旺 請求の範囲 13 - 14 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。
つまり、
人の治療方法を含むものである。
2. r 請求の範囲 _____ は、有意義な国籍調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国籍出願の部分に枠入りのものである。つまり、
3. r 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第III欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

1. r 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. r 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を米めなかった。
3. r 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. r 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

訂 追加調査手数料及び、該当する場合には、異議申立手数料の納付と共に、出願人から異議申立てがあった。

r 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあったが、異議申立手数料が納付命令書に示した期間内に支払われなかった。

┐ 追加調査手数料の納付はあったが、異議申立てはなかった。

請求の範囲1は、多種多様なアミノ酸配列からなる、非常に多数のペプチドを包含している。

しかしながら、PCT第5条の意味において明細書に開示されているのは、クレームされた多数のペプチドのうちのごくわずかな部分に過ぎず、PCT第6条の意味で十分に裏付けられていない。

したがって調査は、明細書に具体的に記載されている、配列番号1～6のいずれかに示されるアミノ酸配列からなるペプチドについて行った。