

【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20年2月7日(2008.2.7)

【公表番号】特表2007-518818(P2007-518818A)

【公表日】平成19年7月12日(2007.7.12)

【年通号数】公開・登録公報2007-026

【出願番号】特願2006-551350(P2006-551350)

【国際特許分類】

A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 P	39/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	37/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
C 0 7 K	5/00	(2006.01)
C 0 7 K	5/10	(2006.01)
C 0 7 K	5/107	(2006.01)
C 0 7 K	5/117	(2006.01)
C 0 7 K	7/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	37/02	
A 6 1 P	39/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	37/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	25/00	
C 0 7 K	5/00	Z N A
C 0 7 K	5/10	
C 0 7 K	5/107	
C 0 7 K	5/117	
C 0 7 K	7/00	

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月6日(2007.12.6)

【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】

以下の性質を有する芳香族カチオン性ペプチドの有効量を含む、哺乳動物における酸化的損傷軽減用医薬組成物：

- (a) 少なくとも1個の正電荷を有する；
- (b) 最小限3個のアミノ酸を有する；
- (b) 最大約20のアミノ酸を有する；
- (d) 正味の正電荷の最小数(p_m)とアミノ酸残基の総数(r)の間に、 $3p_m$ が $r + 1$ 以下の最大の数であるという関係がある；
- (e) 芳香族基の最小数(a)と正味の正電荷の総数(p_t)との間に、 $3a$ が $p_t + 1$ 以下の最大の数であるという関係を有し、ただし、 a が1である場合は、 p_t も1であってよく；および、
- (f) 少なくとも一つのチロシンまたはトリプトファンを含む。

【請求項2】

$2p_m$ が $r + 1$ 以下の最大の数である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項3】

a が p_t に等しい、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項4】

ペプチドが最小限2個の正電荷を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項5】

ペプチドが最小限3個の正電荷を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項6】

ペプチドが水溶性である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項7】

ペプチドが1以上のD-アミノ酸を含む、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項8】

C-末端のアミノ酸のC-末端カルボキシル基がアミド化されている、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項9】

ペプチドが1以上の非天然アミノ酸を含む、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項10】

ペプチドが最小限4個のアミノ酸を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項11】

ペプチドが最大約12個のアミノ酸を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項12】

ペプチドが最大約9個のアミノ酸を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項13】

ペプチドが最大約6個のアミノ酸を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項14】

ペプチドが μ -オピオイドレセプターagonist活性を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項15】

ペプチドが μ -オピオイドレセプターagonist活性を有しない、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項16】

ペプチドが式D-Arg-Dmt-Lys-Phe-NH₂で表される、請求項15記載の医薬組成物。

【請求項17】

ペプチドがN-末端にチロシン残基を含む、請求項14記載の医薬組成物。

【請求項18】

ペプチドが、N-末端に2',6'-ジメチルチロシン残基を含む、請求項17記載の医薬組成物。

【請求項19】

ペプチドが、N-末端にD-アルギニン残基を含む、請求項15記載の医薬組成物。

【請求項20】

ペプチドが、N-末端にフェニルアラニン残基を含む、請求項15記載の医薬組成物。

【請求項21】

ペプチドがN-末端に2',6'-ジメチルフェニルアラニン残基を含む、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項22】

ペプチドが式Tyr-D-Arg-Phe-Lys-NH₂(DALDA)で表される、請求項17記載の医薬組成物。

【請求項23】

ペプチドが式2',6'-Dmt-D-Arg-Phe-Lys-NH₂(Dmt¹-DALDA)で表される、請求項18記載の医薬組成物。

【請求項24】

ペプチドが式Phe-D-Arg-Dmt-Lys-NH₂で表される、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項25】

ペプチドが式2',6'-Dmp-D-Arg-Dmt-Lys-NH₂で表される、請求項21記載の医薬組成物。

。

【請求項26】

経口投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項27】

局所投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項28】

経鼻的投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項29】

全身的投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項30】

静脈内投与用の、請求項27記載の医薬組成物。

【請求項31】

皮下投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項32】

筋肉内投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項33】

脳室内投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項34】

くも膜下腔内投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項35】

経皮投与用の、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項36】

経皮投与がイオン導入による、請求項35記載の医薬組成物。

【請求項37】

哺乳動物が再灌流を受けている、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3 8】

再灌流が虚血の治療である、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3 9】

虚血が脳卒中のためである、請求項 3 8 記載の医薬組成物。

【請求項 4 0】

哺乳動物が敗血症に罹っている、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 4 1】

哺乳動物が炎症性疾患に罹っている、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 4 2】

哺乳動物が関節炎に罹っている、請求項 4 1 記載の医薬組成物。

【請求項 4 3】

哺乳動物が糖尿病に罹っている、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 4 4】

哺乳動物が多発性硬化症に罹っている、請求項 4 1 記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

哺乳動物が肝臓損傷を受けている、請求項 4 5 記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

肝臓障害がウイルス感染によって引き起こされている、請求項 4 5 記載の医薬組成物。

【請求項 4 7】

肝臓損傷が毒物によって引き起こされている、請求項 4 5 記載の医薬組成物。

【請求項 4 8】

哺乳動物が神経変性疾患に罹っているまたは神経変性状態にある、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 4 9】

神経変性疾患または状態がパーキンソン病である、請求項 4 8 記載の医薬組成物。

【請求項 5 0】

神経変性疾患または状態がアルツハイマー病である、請求項 4 8 記載の医薬組成物。

【請求項 5 1】

神経変性疾患または状態がハンチントン病である、請求項 4 8 記載の医薬組成物。

【請求項 5 2】

神経変性疾患または状態が筋萎縮性側索硬化 (ALS) である、請求項 4 8 記載の医薬組成物。

【請求項 5 3】

哺乳動物がヒトである、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 5 4】

以下の性質を有する芳香族カチオン性ペプチドの有効量を取り出した哺乳動物の器官に投与することを含む、取り出した哺乳動物の器官における酸化的損傷を軽減する方法：

(a) 少なくとも 1 個の正味の正電荷を有する；

(b) 最小限 4 個のアミノ酸を有する；

(b) 最大約 20 のアミノ酸を有する；

(d) 正味の正電荷の最小数 (p_m) とアミノ酸残基の総数 (r) の間に、 $3 p_m$ が $r + 1$ 以下の最大の数であるという関係がある；

(e) 芳香族基の最小数 (a) と正味の正電荷の総数 (p_t) との間に、 $2 a$ が $p_t + 1$ 以下の最大の数であるという関係があり、ただし、 a が 1 である場合は、 p_t も 1 であってよく；および、

(f) 少なくとも一つのチロシンまたはトリプトファンを含む。

【請求項 5 5】

以下の性質を有する芳香族カチオン性ペプチドの有効量を含む、哺乳動物における酸化的損傷軽減用医薬組成物：

- (a) 少なくとも 1 個の正味の正電荷を有する；
- (b) 最小限 3 個のアミノ酸を有する；
- (b) 最大約20のアミノ酸を有する；
- (d) 正味の正電荷の最小数(p_m)とアミノ酸残基の総数(r)の間に、 $3 p_m$ が $r + 1$ 以下の最大の数であるという関係がある；
- (e) 芳香族基の最小数(a)と正味の正電荷の総数(p_t)との間に、 $2 a$ が $p_t + 1$ 以下の最大の数であるという関係があり、ただし、 a が 1 である場合は、 p_t も 1 であってよく；および、
- (f) 少なくとも一つのチロシンまたはトリプトファンを含む。

【請求項 5 6】

以下の性質を有する芳香族カチオン性ペプチドの有効量を取り出した哺乳動物の器官に投与することを含む、取り出した哺乳動物の器官における酸化的損傷を軽減する方法：

- (a) 少なくとも 1 個の正味の正電荷を有する；
- (b) 最小限 3 個のアミノ酸を有する；
- (b) 最大約20のアミノ酸を有する；
- (d) 正味の正電荷の最小数(p_m)とアミノ酸残基の総数(r)の間に、 $3 p_m$ が $r + 1$ 以下の最大の数であるという関係がある；
- (e) 芳香族基の最小数(a)と正味の正電荷の総数(p_t)との間に、 $3 a$ が $p_t + 1$ 以下の最大の数であるという関係があり、ただし、 a が 1 である場合は、 p_t も 1 であってよく；および、
- (f) 少なくとも一つのチロシンまたはトリプトファンを含む。

【請求項 5 7】

以下の性質を有する芳香族カチオン性ペプチドの有効量を細胞に投与することを含む、細胞における酸化的損傷を軽減する方法：

- (a) 少なくとも 1 個の正味の正電荷を有する；
- (b) 最小限 3 個のアミノ酸を有する；
- (b) 最大約20のアミノ酸を有する；
- (d) 正味の正電荷の最小数(p_m)とアミノ酸残基の総数(r)の間に、 $3 p_m$ が $r + 1$ 以下の最大の数であるという関係がある；
- (e) 芳香族基の最小数(a)と正味の正電荷の総数(p_t)との間に、 $3 a$ が $p_t + 1$ 以下の最大の数であるという関係があり、ただし、 a が 1 である場合は、 p_t も 1 であってよく；および、
- (f) 少なくとも一つのチロシンまたはトリプトファンを含む。