

【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】

 $2 p_m$ 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アゴニスト活性を有する、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アゴニスト活性を有しない、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

ペプチドが式 $\text{D-Arg-Dmt-Lys-Phe-NH}_2$ で表される、請求項 1 5 記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

ペプチドが N-末端にチロシン残基を含む、請求項 1 4 記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

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 1 7 記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

ペプチドが、N-末端に D-アルギニン残基を含む、請求項 1 5 記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

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 1 5 記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

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 2 0 記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

ペプチドが式 $\text{Tyr-D-Arg-Phe-Lys-NH}_2$ (DALDA) で表される、請求項 1 7 記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

ペプチドが式 $2',6'\text{-Dmt-D-Arg-Phe-Lys-NH}_2$ ($\text{Dmt}^1\text{-DALDA}$) で表される、請求項 1 8 記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

ペプチドが式 $\text{Phe-D-Arg-Dmt-Lys-NH}_2$ で表される、請求項 2 0 記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

ペプチドが式 $2',6'\text{-Dmp-D-Arg-Dmt-Lys-NH}_2$ で表される、請求項 2 1 記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

経口投与用の、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

局所投与用の、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

経鼻的投与用の、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

全身的投与用の、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3 0】

静脈内投与用の、請求項 2 7 記載の医薬組成物。

【請求項 3 1】

皮下投与用の、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

筋肉内投与用の、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

脳室内投与用の、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

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 3 5】

経皮投与用の、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3 6】

経皮投与がイオン導入による、請求項 3 5 記載の医薬組成物。

【請求項 3 7】

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 38】

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 39】

虚血が脳卒中のためである、請求項 38 記載の医薬組成物。

【請求項 40】

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 41】

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 42】

哺乳動物が関節炎に罹っている、請求項 41 記載の医薬組成物。

【請求項 43】

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 44】

哺乳動物が多発性硬化症に罹っている、請求項 41 記載の医薬組成物。

【請求項 45】

哺乳動物が肝臓損傷を受けている、請求項 45 記載の医薬組成物。

【請求項 46】

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 45 記載の医薬組成物。

【請求項 47】

肝臓損傷が毒物によって引き起こされている、請求項 45 記載の医薬組成物。

【請求項 48】

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 49】

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 48 記載の医薬組成物。

【請求項 50】

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 48 記載の医薬組成物。

【請求項 51】

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 48 記載の医薬組成物。

【請求項 52】

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 48 記載の医薬組成物。

【請求項 53】

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 54】

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 55】

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56】

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57】

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。