

【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26年5月8日 (2014.5.8)

【公表番号】特表2013-523629(P2013-523629A)

【公表日】平成25年6月17日 (2013.6.17)

【年通号数】公開・登録公報2013-031

【出願番号】特願2013-500647(P2013-500647)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/22 (2006.01)

A 6 1 K 38/27 (2006.01)

A 6 1 K 38/26 (2006.01)

A 6 1 K 38/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 37/24

A 6 1 K 37/36

A 6 1 K 37/28

A 6 1 K 37/43

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/10

【手続補正書】

【提出日】平成26年3月18日 (2014.3.18)

【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】

ソマトスタチン・タイプ 1 , タイプ 2 , タイプ 3 , タイプ 4 または タイプ 5 受容体アナログ、またはこれらの任意の組合せの脂肪酸塩である、ペプチドの脂肪酸塩。

【請求項 2】

前記ソマトスタチンアナログは、ソマトスタチン・タイプ 2 受容体選択性作動薬である、請求項 1 に記載のペプチドの脂肪酸塩。

【請求項 3】

前記ソマトスタチンアナログは、

D - 2 - NaI - c(Cys - Tyr - D - Trp - Lys - Val - Cys) - Thr - NH₂ ;

D - Phe - c(Cys - Phe - D - Trp - Lys - Thr - Cys) - Thr - ol ;

[4 - (2 - ヒドロキシエチル)] - 1 - ピペラジニルアセチル - D - Phe - c(Cys - Tyr - D - Trp - Lys - Abu - Cys) - Thr - NH₂ ;

c(Tic - Tyr - D - Trp - Lys - Abu - Phe) ;

4 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - ピペラジン - 2 - エタンスルホニル - D - Phe - c(Cys - Tyr - D - Trp - Lys - Abu - Cys) - Thr - NH₂ ;

[4 - (2 - ヒドロキシエチル)] - 1 - ピペラジニルアセチル - D - Phe - c(Cys - Tyr - D - Trp - Lys - Abu - Cys) - Thr - NH₂ ;

D - 6 - プロピル - 8 - エルゴリニルメチル - チオアセチル - D - Lys(D - 6 - プロピル - 8 - エルゴリニルメチル - チオアセチル) - c(Cys - Tyr - D - Trp - Lys - Abu - Cys) - Thr - NH₂ ;

D - Cpa - c(Cys - Tyr - D - Trp - Lys - Val - Cys) - Thr - NH₂ ;

D - Phe - Cpa - Tyr - D - Trp - Lys - Val - Phe - Thr - NH₂ ;

D - Phe - Cpa - Tyr - D - Trp - Lys - Thr - Phe - Thr - NH₂ ; および

Ac - c(Cys - Lys - Asn - Cpa - Phe - D - Trp - Lys - Thr - Phe - Thr - Ser - D - Cys) - NH₂

からなる群より選択されるソマトスタチン・タイプ2受容体作動薬である、請求項1に記載のペプチドの脂肪酸塩。

【請求項4】

前記ソマトスタチン・タイプ2受容体作動薬は、

D - 2 - Nal - c(Cys - Tyr - D - Trp - Lys - Val - Cys) - Thr - NH₂ ;

D - Phe - c(Cys - Phe - D - Trp - Lys - Thr - Cys) - Thr - ol ; または

[4 - (2 - ヒドロキシエチル)] - 1 - ピペラジニルアセチル - D - Phe - c(Cys - Tyr - D - Trp - Lys - Abu - Cys) - Thr - NH₂

のジオレイン酸塩である、請求項3に記載のペプチドの脂肪酸塩。

【請求項5】

前記脂肪酸は、オクタン酸、ノナン酸、デカン酸、ドデカン酸、テトラデカン酸、cis - 9 - オクタデカン酸およびcis, cis - 9,12 - オクタデカン酸からなる群より選択される、請求項1～4のいずれかに記載のペプチドの脂肪酸塩。

【請求項6】

前記脂肪酸がcis - 9 - オクタデカン酸である、請求項5に記載のペプチドの脂肪酸塩

。

【請求項7】

請求項1～6のいずれかに記載のペプチドの脂肪酸塩を含む経皮送達用組成物。

【請求項8】

化学的透過促進剤をさらに含む、請求項7に記載の組成物。

【請求項9】

前記化学的透過促進剤は、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、デカノール、ドデカノール、オレイン酸、1, 8 - シネオール、プロピレングリコールおよびラウリル硫酸ナトリウムからなる群より選択される、請求項8に記載の組成物。

【請求項10】

請求項1～6のいずれかに記載のペプチドの脂肪酸塩の経皮送達に用いる経皮送達デバイス。

【請求項11】

ペプチドの生物学的利用能を変化させる方法であって、

該ペプチドの親油性を増大させることを含み、

該増大は、請求項1～6のいずれかに記載の該ペプチドの脂肪酸塩の調製を含む、方法

。