

【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5年12月11日(2023.12.11)

【国際公開番号】WO2021/110061

【公表番号】特表2023-503380(P2023-503380A)

【公表日】令和5年1月27日(2023.1.27)

【年通号数】公開公報(特許)2023-017

【出願番号】特願2022-532785(P2022-532785)

【国際特許分類】

C 0 7 K 7/06(2006.01)

C 0 7 K 7/08(2006.01)

A 6 1 P 29/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 K 38/08(2019.01)

【F I】

C 0 7 K 7/06 Z N A

C 0 7 K 7/08

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 38/08

【手続補正書】

【提出日】令和5年12月1日(2023.12.1)

【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】

以下のアミノ酸配列を含む化合物、並びに前記化合物の位置異性体、立体異性体、及び薬学的又は美容的に許容される塩であって、

W - L y s - X¹ - S e r - U - X² - Y - G

式中、

Wが、1つ又は2つのアミノ酸配列を表し、前記アミノ酸が、群L y s、A l a及びD O P Aのうち1つ又は複数から選択され、配列が、任意選択で、3,4-ジヒドロ桂皮酸(H C A)残基によってN終結され、

X¹が、P r o、H y p、又はd i H y pを表し、

UがT y r又はD O P Aを表し、

X²が、S e r、P r o、H y p、又はd i H y pを表し、

Yが、1~5のアミノ酸配列を表し、ここで、前記アミノ酸が、群L y s、A l a、P r o、H y p、d i H y p、T h r、D O P A、及びT y rのうち1つ又は複数から選択され、

Gが存在しないか、あるいはD O P A又はドーパミンを表す、

化合物、並びに前記化合物の位置異性体、立体異性体、及び薬学的又は美容的に許容される塩。

ただし、前記化合物は、

10

20

30

40

50

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - DOPA - Hyp - Lys ;

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Tyr - Hyp - Lys ;

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - DOPA - Hyp - Lys ;

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Tyr - Hyp - Lys ;

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - DOPA - Hyp ;

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Tyr - Hyp ; 10

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - DOPA - Hyp ;

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Tyr - Hyp ;

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Tyr - Lys ;

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Tyr - Hyp - Lys ;

Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Thr - DOPA - Hyp - Lys ;

Ala - Lys - Hyp - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Tyr - Hyp - Lys ;

Ala - Lys - Hyp - Ser - DOPA - Hyp - Thr - DOPA - Hyp - Lys ; 20

Ala - Lys - Hyp - Ser - Tyr - Hyp - Thr - DOPA - Hyp - Lys ;

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Tyr ;

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Tyr - Hyp ;

Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Thr - DOPA - Hyp ;

Ala - Lys - Hyp - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Tyr - Hyp ;

Ala - Lys - Hyp - Ser - DOPA - Hyp - Thr - DOPA - Hyp ; または

Ala - Lys - Hyp - Ser - Tyr - Hyp - Thr - DOPA - Hyp のいずれでもない。 30

【請求項 2】

G が存在しない、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

X¹ が、Pro を表す、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

X² が、Hyp を表す、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

W が群 HCA、HCA - Ala -、Ala、DOPA、Lys - Ala - 及び DOPA - Ala - から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。 40

【請求項 6】

Y が、4 つのアミノ酸配列を表し、前記アミノ酸が、群 Lys、Ala、Hyp、Thr、DOPA、及び Tyr の群のうちの 1 つ又は複数から選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

Y が 4 つのアミノ酸配列を表し、前記アミノ酸が群 - Pro - Y¹ - Y² - Lys -、- Hyp - Y¹ - Y² - Lys - 及び - Thr - Y¹ - Y² - Lys - から選択され、Y¹ 及び Y² がそれぞれ、群 Ala、Hyp、Pro、Thr、DOPA 及び Tyr から独立して選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記 Y によって定義されるアミノ酸配列が、群 - Hyp - Thr - Tyr - Lys - 、
- Hyp - Thr - DOPA - Lys - 、 - Hyp - Thr - Ala - Lys - 、 - Thr
- Tyr - Hyp - Lys - 、 - Thr - DOPA - Hyp - Lys - 及び - Thr -
Ala - Hyp - Lys - から選択される、請求項 6 又は 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

前記 Y によって定義されるアミノ酸配列が、群 - Hyp - Thr - 、 - Thr - Tyr
- 、 - Thr - DOPA - 、 - Hyp - Thr - Tyr - 、 - Hyp - Thr - Tyr -
Hyp - Lys - 、 - Thr - Tyr - Hyp - Lys - DOPA - 及び - Hyp - Thr
- DOPA - から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

前記化合物が、アミノ酸配列：

DOPA - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Ala - Hyp - Lys
s (配列番号 5)

DOPA - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Ala - Lys
s (配列番号 6)

DOPA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Tyr - Hyp
p - Lys (配列番号 7)

DOPA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Tyr
r - Lys (配列番号 8)

DOPA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - DOPA - H
yp - Lys (配列番号 9) 20

DOPA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - DO
PA - Lys (配列番号 10)、

DOPA - Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Thr - Tyr - H
yp - Lys (配列番号 11)、

Lys - Ala - Lys - Hyp - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Tyr
(配列番号 12)、

Lys - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Tyr
(配列番号 14)、

HCA - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Ala - Lys
(配列番号 15)、 30

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Tyr - Hyp
- Lys (配列番号 17)、

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - DOPA - Hyp
p - Lys (配列番号 18)、

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Thr - DOPA - H
yp - Lys (配列番号 19)、

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - Tyr
- Lys (配列番号 20)、

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - DOP
A - Lys (配列番号 21)、 40

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Hyp - Thr - DO
PA - Lys (配列番号 22)、

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Thr - Tyr - Hyp
p - Lys (配列番号 23)、

HCA - Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Hyp - Thr - Tyr
r - Lys (配列番号 24)、

HCA - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Thr - Ala - Hyp - Lys
(配列番号 25)、

HCA - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Thr - Ala - Hyp - Lys 50

10

20

30

40

50

- s (配列番号 26)、
H C A - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - H y p - T h r - A l a - L y s
- s (配列番号 27)、
D O P A - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - T h r - A l a - H y p - L y s
- s (配列番号 28)、
D O P A - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - H y p - T h r - A l a - L y s
- s (配列番号 29)、
D O P A - A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - T h r - D O P A - H y p - L y s
- (配列番号 30)、
D O P A - A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - H y p - T h r - T y r - L y s
- (配列番号 31)、
D O P A - A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - H y p - T h r - D O P A - L y s
- (配列番号 32)、または
A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - T h r - T y r - H y p - L y s
- (配列番号 35) を有する、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。
- 【請求項 11】
G が D O P A 及び / 又はドーパミンを表す、請求項 1 に記載の化合物。
- 【請求項 12】
W が A l a 又は L y s - A l a を表す、請求項 1 又は 11 に記載の化合物。
- 【請求項 13】
前記化合物が、アミノ酸配列：
A l a - L y s - P r o - S e r - T y r - H y p - T h r - T y r - H y p - L y s - D O P A (配列番号 38)、
A l a - L y s - P r o - S e r - T y r - H y p - T h r - T y r - H y p - L y s - ドーパミン (配列番号 39)、
A l a - L y s - P r o - S e r - T y r - H y p - H y p - T h r - T y r - L y s - ドーパミン (配列番号 40)、
A l a - L y s - P r o - S e r - T y r - H y p - H y p - T h r - T y r - L y s - D O P A (配列番号 41)、
A l a - L y s - P r o - S e r - T y r - H y p - H y p - T h r - D O P A - L y s - D O P A (配列番号 42)、
A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - H y p - T h r - T y r - L y s - D O P A (配列番号 43)、
A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - H y p - T h r - D O P A - L y s - D O P A (配列番号 44)、
A l a - L y s - P r o - S e r - T y r - H y p - H y p - T h r - D O P A - L y s - ドーパミン (配列番号 45)、
A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - H y p - T h r - T y r - L y s - ドーパミン (配列番号 46)、
A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - H y p - T h r - D O P A - L y s - ドーパミン (配列番号 47)、
A l a - L y s - P r o - S e r - T y r - H y p - T h r - D O P A - H y p - L y s - D O P A (配列番号 48)、
A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - T h r - T y r - H y p - L y s - D O P A (配列番号 49)、
A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - T h r - D O P A - H y p - L y s - D O P A (配列番号 50)、
A l a - L y s - P r o - S e r - T y r - H y p - T h r - D O P A - H y p - L y s - ドーパミン (配列番号 51)、
A l a - L y s - P r o - S e r - D O P A - H y p - T h r - T y r - H y p - L y s

s - ドーパミン (配列番号 52)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Thr - DOPA - Hyp - Lys - ドーパミン (配列番号 53)、
 Lys - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - DOPA (配列番号 54)、
 Lys - Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - ドーパミン (配列番号 55)、
 Lys - Ala - Lys - Hyp - Ser - Tyr - Hyp - Hyp - Thr - DOPA (配列番号 56)、
 Lys - Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Hyp - Thr - DOPA (配列番号 57)、
 Lys - Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Hyp - Thr - ドーパミン (配列番号 58)、又は
 Lys - Ala - Lys - Hyp - Ser - DOPA - Hyp - Hyp - Thr - DOPA (配列番号 59) を有する、請求項 12 に記載の化合物。

10

【請求項 14】

W が Ala を表し、
 X¹ が、Pro を表し、
 X² が、Pro を表し、
 Y が、群 - Thr - Tyr - Pro - Lys - 及び - Thr - DOPA - Pro - Lys - 、 - Pro - Thr - DOPA - Lys - 、 - Pro - Thr - Tyr - Lys - 、 - Thr - Tyr - Lys - 、 - Tyr - Pro - Lys - 及び - DOPA - Pro - Lys - から選択されるか、並びに / あるいは
 G が存在しない、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物。

20

【請求項 15】

前記化合物が、アミノ酸配列：
 Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Pro - Pro - Thr - DOPA - Lys (配列番号 60)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Pro - Pro - Thr - Tyr - Lys (配列番号 61)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Pro - Pro - Thr - DOPA - Lys (配列番号 62)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Pro - Thr - Tyr - Pro - Lys (配列番号 63)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Pro - Thr - DOPA - Pro - Lys (配列番号 64)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Pro - Thr - Tyr - Pro - Lys (配列番号 65)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Pro - Thr - DOPA - Pro - Lys (配列番号 66)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Pro - Hyp - Thr - Tyr - Lys (配列番号 67)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Pro - Hyp - Thr - DOPA - Lys (配列番号 68)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Pro - Hyp - Thr - Tyr - Lys (配列番号 69)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Pro - Hyp - Thr - DOPA - Lys (配列番号 70)、
 Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Pro - Thr - Tyr - Lys (配列番号 71)、

30

40

50

Ala - Lys - Pro - Ser - Tyr - Hyp - Pro - Thr - DOPA - Lys (配列番号 72)、

Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Pro - Thr - Tyr - Lys (配列番号 73)、又は

Ala - Lys - Pro - Ser - DOPA - Hyp - Pro - Thr - DOPA - Lys (配列番号 74) を有する請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に定義される化合物と、薬学的又は美容的に許容されるアジュバント、希釈剤、又は担体と、とを含む、医薬製剤。

【請求項 17】

局所投与用の、前記薬学的又は美容的に許容されるアジュバント、希釈剤、又は担体が、局所アジュバント、希釈剤、又は担体である、請求項 16 に記載の医薬製剤。

【請求項 18】

ゲル、スプレー、クリーム、軟膏、又は乾燥粉末の形態である、請求項 16 又は 17 に記載の医薬製剤。

【請求項 19】

別の抗炎症剤、又は副作用として炎症を生じさせることが知られている薬剤を更に含む、請求項 16 ~ 18 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 20】

以下の構成要素：

(A) 請求項 16 ~ 18 のいずれか一項に記載の医薬製剤と、

(B) 薬学的に許容されるアジュバント、希釈剤、又は担体と混合された、別の抗炎症剤、若しくは副作用として炎症を引き起こすことが知られている薬剤を含む医薬製剤と、とを含むキット・オブ・パーツであって、

構成要素 (A) 及び (B) が、各々、他方と組み合わせた投与に好適な形態で提供される、キット・オブ・パーツ。

【請求項 21】

炎症、炎症性障害、及び / 又は炎症を特徴とする障害の治療における使用のための、請求項 16 ~ 19 のいずれか一項に記載の製剤、又は請求項 20 に記載のキット・オブ・パーツ。

【請求項 22】

炎症、炎症性障害、及び / 又は炎症を特徴とする障害の治療のための薬物を製造するための、請求項 16 ~ 19 のいずれか一項に記載の製剤、又は請求項 20 に記載のキット・オブ・パーツの使用。

【請求項 23】

前記炎症を特徴とする障害が、創傷又は熱傷であるか、あるいは創傷又は熱傷をもたらす、請求項 21 に記載の使用のための製剤、若しくはキット・オブ・パーツ、または請求項 22 に記載の使用。

【請求項 24】

創傷をもたらす前記障害が、痔核又は潰瘍性大腸炎である、請求項 23 に記載の使用のための製剤、若しくはキット・オブ・パーツ、または使用。

【請求項 25】

前記化合物 (複数可) 又はその塩が、局所製剤の形態で局所投与される、請求項 16 ~ 24 のいずれか一項に記載の使用のための製剤、若しくはキット・オブ・パーツ、または使用。

【請求項 26】

前記関連する病態が、前記皮膚への直接局所投与によって治療される、請求項 25 に記載の使用のための製剤、若しくはキット・オブ・パーツ、または使用。

【請求項 27】

前記関連する病態が、粘膜表面への直接局所投与によって治療される、請求項 25 に記

10

20

30

40

50

載の使用のための製剤、若しくはキット・オブ・パーツ、または使用。

【請求項 28】

前記化合物（複数可）が、経口、静脈内、皮膚若しくは皮下、鼻、筋肉内、腹腔内、肺、又は肛門直腸への送達によって投与される、請求項 16 ~ 27のいずれか一項に記載の使用のための製剤、若しくはキット・オブ・パーツ、または使用。

10

20

30

40

50