

【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28年1月28日(2016.1.28)

【公表番号】特表2013-510182(P2013-510182A)

【公表日】平成25年3月21日(2013.3.21)

【年通号数】公開・登録公報2013-014

【出願番号】特願2012-538087(P2012-538087)

【国際特許分類】

C 0 7 K	4/00	(2006.01)
C 0 7 K	7/08	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/22	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	1/08	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/14	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)

【F I】

C 0 7 K	4/00	Z N A
C 0 7 K	7/08	
A 6 1 K	37/02	
A 6 1 K	47/02	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/18	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	47/36	
A 6 1 K	47/22	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/14	
A 6 1 K	47/38	
A 6 1 K	47/26	

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	1/08	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	9/48	
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/14	
A 6 1 P	3/10	

**【誤訳訂正書】****【提出日】**平成27年12月1日(2015.12.1)**【誤訳訂正1】****【訂正対象書類名】**特許請求の範囲**【訂正対象項目名】**全文**【訂正方法】**変更**【訂正の内容】****【特許請求の範囲】****【請求項1】**

ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、該ペプチドがアミノ酸配列：

**【化10】**

Asp Asp Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;

Asp Asp Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;

Asp Asp Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;

Asp Asp Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;

Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;

Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;

Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr; または

Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys.

からなる、ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

**【請求項2】**

単離されたものであるか精製されたものである、請求項1に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

**【請求項3】**

請求項1～2のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩を含む薬学的組成物。

**【請求項4】**薬学的に許容されるキャリア、請求項1～2のいずれか一項に記載のペプチド、および(i)Mg<sup>2+</sup>、Ca<sup>2+</sup>、Zn<sup>2+</sup>、Mn<sup>2+</sup>、K<sup>+</sup>、Na<sup>+</sup>もしくはAl<sup>3+</sup>から選択されるカチオン、または(ii)立体障害型一级アミンから選択される1つまたは複数の作用物質を含む薬学的組成物。**【請求項5】**

前記  $Mg^{2+}$ 、 $Ca^{2+}$ 、 $Zn^{2+}$ 、 $Mn^{2+}$ 、 $K^+$ 、 $Na^+$  または  $Al^{3+}$  が、酢酸マグネシウム、塩化マグネシウム、リン酸マグネシウム、硫酸マグネシウム、酢酸カルシウム、塩化カルシウム、リン酸カルシウム、硫酸カルシウム、酢酸亜鉛、塩化亜鉛、リン酸亜鉛、硫酸亜鉛、酢酸マンガン、塩化マンガン、リン酸マンガン、硫酸マンガン、酢酸カリウム、塩化カリウム、リン酸カリウム、硫酸カリウム、酢酸ナトリウム、塩化ナトリウム、リン酸ナトリウム、硫酸ナトリウム、酢酸アルミニウム、塩化アルミニウム、リン酸アルミニウムまたは硫酸アルミニウムとして提供される、請求項 4 に記載の薬学的組成物。

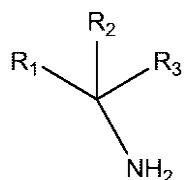
#### 【請求項 6】

前記立体障害型一級アミンが、天然に存在するアミノ酸、天然に存在しないアミノ酸、またはアミノ酸誘導体から選択されるアミノ酸であり、ここで、該天然に存在するアミノ酸がヒスチジン、フェニルアラニン、アラニン、グルタミン酸、アスパラギン酸、グルタミン、ロイシン、メチオニン、アスパラギン、チロシン、トレオニン、イソロイシン、トリプトファンもしくはバリンであり、該天然に存在しないアミノ酸が 1 - アミノシクロヘキサンカルボン酸、ランタニンもしくはテアニンである、請求項 4 に記載の薬学的組成物。

#### 【請求項 7】

前記立体障害型一級アミンが式：

#### 【化 1 1】



を有し、ここで、 $R_1$ 、 $R_2$  および  $R_3$  が、H、C(O)OH、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルエーテル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオエーテル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルカルボン酸、 $C_1 \sim C_6$  アルキルカルボキシリルアミドおよびアルキルアリールから独立して選択され、ここで、任意の基がハロゲンまたはアミノによって単独でまたは多重に置換されてよく、ただし、 $R_1$ 、 $R_2$  および  $R_3$  の 1 つ以下が H である、請求項 4 に記載の薬学的組成物。

#### 【請求項 8】

前記立体障害型一級アミンがシクロヘキシリルアミン、2 - メチルブチルアミン、重合アミン、または、キトサンから選択される、請求項 4 に記載の薬学的組成物。

#### 【請求項 9】

薬学的に許容される抗酸化剤、結合剤、添加剤、または充填剤をさらに含む、請求項 3 ~ 8 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

#### 【請求項 10】

前記薬学的に許容される結合剤または添加剤が、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン（ポビドン）、デンブン、マルトデキストリンまたはセルロースエーテルから選択される、請求項 9 に記載の薬学的組成物。

#### 【請求項 11】

前記薬学的に許容される結合剤または添加剤が、メチルセルロース、エチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシエチルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロースおよびヒドロキシプロピルメチルセルロースから選択されるセルロースエーテルである、請求項 9 に記載の薬学的組成物。

#### 【請求項 12】

前記薬学的に許容される充填剤が、セルロース、イソマルト、マンニトール、ラクトースまたは第二リン酸カルシウムである、請求項 9 に記載の薬学的組成物。

**【請求項 13】**

前記薬学的に許容される充填剤が、微細セルロースおよび微結晶性セルロースから選択されるセルロースである、請求項12に記載の薬学的組成物。

**【請求項 14】**

追加の治療薬をさらに含む、請求項3～13のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

**【請求項 15】**

前記追加の治療薬が、鎮痛剤、抗うつ薬、作動促進剤もしくは運動促進剤、制吐剤、抗生素質、プロトンポンプインヒビター、酸遮断薬、PDE5インヒビター、酸ポンプアンタゴニスト、GABA-Bアゴニスト、胆汁酸隔離剤または粘膜保護剤のうちの1つまたは複数から選択される、請求項14に記載の薬学的組成物。

**【請求項 16】**

請求項3～15のいずれか一項に記載の薬学的組成物を含む投薬単位。

**【請求項 17】**

カプセルまたは錠剤である、請求項16に記載の投薬単位。

**【請求項 18】**

5 μg～1mgの前記ペプチドを含む、請求項16に記載の投薬単位。

**【請求項 19】**

請求項1～2のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩を含む、胃腸障害の処置において使用するための薬学的組成物。

**【請求項 20】**

前記胃腸障害が、胃不全麻痺、術後胃イレウス、機能性食道障害、機能性胃十二指腸障害、胃食道逆流性疾患(GERD)、セリック病、粘膜炎、十二指腸潰瘍もしくは胃潰瘍である、請求項19に記載の薬学的組成物。

**【請求項 21】**

前記胃腸障害が、特発性、糖尿病性または術後の胃不全麻痺から選択される胃不全麻痺である、請求項20に記載の薬学的組成物。

**【請求項 22】**

前記胃腸障害が、機能性胸やけ、食道起源と推定される機能性胸痛、機能性嚥下障害または食道球から選択される機能性食道障害である、請求項20に記載の薬学的組成物。

**【請求項 23】**

前記胃腸障害が、機能性消化不良、おくび障害、吐き気もしくは嘔吐障害、または反芻症候群から選択される機能性胃十二指腸障害である、請求項20に記載の薬学的組成物。

**【誤訳訂正2】**

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0011

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0011】

本発明の第三の態様は、本発明による薬学的組成物を投与することを含む、胃腸障害の処置方法を提供する。

一つの実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、該ペプチドは、

アミノ酸配列：

Xaa<sub>1</sub> Xaa<sub>2</sub> Xaa<sub>3</sub> Xaa<sub>4</sub> Cys<sub>5</sub> Xaa<sub>6</sub> Xaa<sub>7</sub> Xaa<sub>8</sub>

Cys<sub>9</sub> Asn<sub>10</sub> Pro<sub>11</sub> Ala<sub>12</sub> Cys<sub>13</sub> Xaa<sub>14</sub> Gly<sub>1</sub>

5 Xaa<sub>16</sub> Xaa<sub>17</sub> を含み、ここで、

Xaa<sub>1</sub> は、Asn、D-Asn、Gln、D-Gln、Pro、Ala、-Ala

、 D - A l a 、 V a l 、 D - V a l 、 G l y 、 T h r 、 D - T h r 、 A s p 、 D - A s p 、 - カルボキシル化 A s p 、 G l u 、 D - G l u 、 - カルボキシル化 G l u 、 - アミノスベリン酸 ( A s u ) 、 - アミノアジピン酸 ( A a d ) 、 - アミノピメリン酸 ( A p m ) であるか、または存在せず、

X a a <sub>2</sub> は、 A s p 、 - カルボキシル化 A s p 、 G l u 、 - カルボキシル化 G l u 、 A s u 、 A a d 、 A p m であるか、または存在せず、

X a a <sub>3</sub> は、 A s p 、 - カルボキシル化 A s p 、 G l u 、 - カルボキシル化 G l u 、 A s u 、 A a d 、 A p m であるか、または存在せず、

X a a <sub>4</sub> は、 C y s または D - C y s であり、

X a a <sub>6</sub> は、 P - S e r 、 P - T h r 、 P - ホモ - S e r 、 4 - ヒドロキシバリンホスフェート、 P - ホモ - T h r 、 P - C y s または P - T y r であり、

X a a <sub>7</sub> は、 T y r 、 L e u 、 P h e または I l e であり、

X a a <sub>8</sub> は、 C y s または D - C y s であり、

X a a <sub>14</sub> は、 T h r 、 A l a または P h e であり、

X a a <sub>16</sub> は、 C y s または D - C y s であり、ならびに

X a a <sub>17</sub> は、 T y r 、 D - T y r であるか、または存在せず、

ここで、

X a a <sub>1</sub> が存在する場合、 X a a <sub>1</sub> はそのアミノ基上でメチル、エタン二酸、プロパン二酸、ブタン二酸、ペンタン二酸、ヘキサン二酸、ヘプタン二酸またはオクタン二酸によって修飾されてもよく、

X a a <sub>1</sub> が存在せず、 X a a <sub>2</sub> が存在する場合、 X a a <sub>2</sub> はそのアミノ基上でメチル、エタン二酸、プロパン二酸、ブタン二酸、ペンタン二酸、ヘキサン二酸、ヘプタン二酸またはオクタン二酸によって修飾されてもよく、

X a a <sub>1</sub> および X a a <sub>2</sub> の両方が存在しない場合、 X a a <sub>3</sub> はそのアミノ基上でメチル、エタン二酸、プロパン二酸、ブタン二酸、ペンタン二酸、ヘキサン二酸、ヘプタン二酸またはオクタン二酸によって修飾されてもよい、

ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目2)

X a a <sub>2</sub> および X a a <sub>3</sub> の両方が存在しない、項目1に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目3)

X a a <sub>2</sub> が A s p または G l u であり、 X a a <sub>3</sub> が存在しない、項目1に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目4)

X a a <sub>2</sub> が A s p または G l u であり、 X a a <sub>3</sub> が A s p または G l u である、項目1に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目5)

X a a <sub>7</sub> が T y r または L e u である、項目1～4のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目6)

X a a <sub>14</sub> が T h r である、項目1～5のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目7)

X a a <sub>17</sub> が T y r であるか、または存在しない、項目1～6のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目8)

X a a <sub>1</sub> が A s n 、 D - A s n 、 G l n 、 D - G l n 、 P r o 、 A l a 、 - A l a 、 D - A l a 、 V a l 、 D - V a l 、 G l y 、 T h r 、 D - T h r 、 A s p 、 D - A s p 、 G l u または D - G l u である、項目1～7のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目9)

Xaa<sub>1</sub>がAsp、D-Asp、GluまたはD-Gluである、項目8に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目10)

Xaa<sub>6</sub>がP-SerまたはP-Thrである、項目1~9のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目11)

Xaa<sub>6</sub>がP-Serである、項目10に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目12)

Xaa<sub>1</sub>、Xaa<sub>2</sub>およびXaa<sub>3</sub>が存在しない、項目1に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目13)

Xaa<sub>7</sub>がTyrまたはLeuである、項目12に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目14)

Xaa<sub>14</sub>がThrである、項目12または13のいずれかに記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目15)

Xaa<sub>17</sub>がTyrであるか、または存在しない、項目12~14のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目16)

Xaa<sub>6</sub>がP-Serである、項目12~15のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目17)

項目16に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、該ペプチドがアミノ酸配列：

Cys<sub>4</sub> Cys<sub>5</sub> P-Ser<sub>6</sub> Xaa<sub>7</sub> Cys<sub>8</sub> Cys<sub>9</sub> Asn<sub>10</sub> Pro<sub>11</sub> Ala<sub>12</sub> Cys<sub>13</sub> Thr<sub>14</sub> Gly<sub>15</sub> Cys<sub>16</sub> Xaa<sub>17</sub>  
を含み、Xaa<sub>7</sub>がTyrまたはLeuである、ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目18)

項目1に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、該ペプチドがアミノ酸配列：

【化9】

Asp Asp Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;

Asp Asp Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;

Asp Asp Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;

Asp Asp Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;

Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;

Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;

Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr; または

Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys

を含む、ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目19)

項目1～18のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、該ペプチドが50、40、30または20個以下のアミノ酸を含む、ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目20)

項目19に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、該ペプチドが19、18、17、16、15または14個以下のアミノ酸を含む、ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目21)

アミノ酸配列：

Xaa<sub>1</sub> Xaa<sub>2</sub> Xaa<sub>3</sub> Xaa<sub>4</sub> Cys<sub>5</sub> Xaa<sub>6</sub> Xaa<sub>7</sub> Cys<sub>8</sub>  
 Cys<sub>9</sub> Asn<sub>10</sub> Pro<sub>11</sub> Ala<sub>12</sub> Cys<sub>13</sub> Xaa<sub>14</sub> Gly<sub>15</sub>  
 Cys<sub>16</sub> Xaa<sub>17</sub> からなるペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、ここで、

Xaa<sub>1</sub> は、Asn、D-Asn、Gln、D-Gln、Pro、Ala、-Ala、D-Ala、Val、D-Val、Gly、Thr、D-Thr、Asp、D-Asp、-カルボキシル化Asp、Glu、D-Glu、-カルボキシル化Glu、-アミノスベリン酸(Asu)、-アミノアジピン酸(Aad)、-アミノピメリン酸(Apm)であるか、または存在せず、

Xaa<sub>2</sub> は、Asp、-カルボキシル化Asp、Glu、-カルボキシル化Glu、Asu、Aad、Apmであるか、または存在せず、

Xaa<sub>3</sub> は、Asp、-カルボキシル化Asp、Glu、-カルボキシル化Glu、Asu、Aad、Apmであるか、または存在せず、

Xaa<sub>4</sub> は、CysまたはD-Cysであり、

Xaa<sub>6</sub> は、P-Ser、P-Thr、P-ホモ-Ser、4-ヒドロキシバリンホスフェート、P-ホモ-Thr、P-CysまたはP-Tyrであり、

Xaa<sub>7</sub> は、Tyr、Leu、PheまたはIleであり、

Xaa<sub>8</sub> は、CysまたはD-Cysであり、

Xaa<sub>14</sub> は、Thr、AlaまたはPheであり、

Xaa<sub>16</sub> は、CysまたはD-Cysであり、ならびに

Xaa<sub>17</sub> は、Tyr、D-Tyrであるか、または存在せず、

ここで、

Xaa<sub>1</sub> が存在する場合、Xaa<sub>1</sub> はそのアミノ基上でメチル、エタン二酸、プロパン二酸、ブタン二酸、ペンタン二酸、ヘキサン二酸、ヘプタン二酸またはオクタン二酸によって修飾されてもよく、

Xaa<sub>1</sub> が存在せず、Xaa<sub>2</sub> が存在する場合、Xaa<sub>2</sub> はそのアミノ基上でメチル、エタン二酸、プロパン二酸、ブタン二酸、ペンタン二酸、ヘキサン二酸、ヘプタン二酸またはオクタン二酸によって修飾されてもよく、

Xaa<sub>1</sub> およびXaa<sub>2</sub> の両方が存在しない場合、Xaa<sub>3</sub> はそのアミノ基上でメチル、エタン二酸、プロパン二酸、ブタン二酸、ペンタン二酸、ヘキサン二酸、ヘプタン二酸またはオクタン二酸によって修飾されてもよい、

ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目22)

Xaa<sub>2</sub> およびXaa<sub>3</sub> の両方が存在しない、項目21に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目23)

Xaa<sub>2</sub> がAspまたはGluであり、Xaa<sub>3</sub> が存在しない、項目21に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目24)

Xaa<sub>2</sub>がAspまたはGluであり、Xaa<sub>3</sub>がAspまたはGluである、項目21に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目25)

Xaa<sub>7</sub>がTyrまたはLeuである、項目21～24のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目26)

Xaa<sub>14</sub>がThrである、項目21～25のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目27)

Xaa<sub>17</sub>がTyrであるか、または存在しない、項目21～26のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目28)

Xaa<sub>1</sub>がAsn、D-Asn、Gln、D-Gln、Pro、Ala、-Ala、D-Ala、Val、D-Val、Gly、Thr、D-Thr、Asp、D-Asp、GluまたはD-Gluである、項目21～27のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目29)

Xaa<sub>1</sub>がAsp、D-Asp、GluまたはD-Gluである、項目28に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目30)

Xaa<sub>6</sub>がP-SerまたはP-Thrである、項目21～29のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目31)

Xaa<sub>6</sub>がP-Serである、項目30に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目32)

Xaa<sub>1</sub>、Xaa<sub>2</sub>およびXaa<sub>3</sub>が存在しない、項目21に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目33)

Xaa<sub>7</sub>がTyrまたはLeuである、項目32に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目34)

Xaa<sub>14</sub>がThrである、項目32または33のいずれかに記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目35)

Xaa<sub>17</sub>がTyrであるか、または存在しない、項目32～34のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目36)

Xaa<sub>6</sub>がP-Serである、項目32～35のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目37)

項目36に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、該ペプチドがアミノ酸配列：

Cys<sub>4</sub> Cys<sub>5</sub> P-Ser<sub>6</sub> Xaa<sub>7</sub> Cys<sub>8</sub> Cys<sub>9</sub> Asn<sub>10</sub> Pro<sub>11</sub> Ala<sub>12</sub> Cys<sub>13</sub> Thr<sub>14</sub> Gly<sub>15</sub> Cys<sub>16</sub> Xaa<sub>17</sub>  
からなり、Xaa<sub>7</sub>がTyrまたはLeuである、ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

(項目38)

項目32に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩であって、該ペプチドがアミノ酸配列：

## 【化10】

Asp Asp Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;  
 Asp Asp Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;  
 Asp Asp Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;  
 Asp Asp Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;  
 Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys Tyr;  
 Cys Cys P-Ser Leu Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys;  
 Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys; または  
 Cys Cys P-Ser Tyr Cys Cys Asn Pro Ala Cys Thr Gly Cys

からなる、ペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

## (項目39)

単離されているものである、項目1～38のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

## (項目40)

精製されているものである、項目39に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩。

## (項目41)

項目1～40のいずれか一項に記載のペプチドまたは薬学的に許容されるその塩を含む薬学的組成物。

## (項目42)

薬学的に許容されるキャリア、項目1～40のいずれか一項に記載のペプチド、および(i) Mg<sup>2+</sup>、Ca<sup>2+</sup>、Zn<sup>2+</sup>、Mn<sup>2+</sup>、K<sup>+</sup>、Na<sup>+</sup>もしくはAl<sup>3+</sup>から選択されるカチオン、または(ii) 立体障害型一級アミンから選択される1つまたは複数の作用物質を含む薬学的組成物。

## (項目43)

前記作用物質がMg<sup>2+</sup>、Ca<sup>2+</sup>、Zn<sup>2+</sup>、Mn<sup>2+</sup>、K<sup>+</sup>、Na<sup>+</sup>またはAl<sup>3+</sup>である、項目42に記載の薬学的組成物。

## (項目44)

前記Mg<sup>2+</sup>、Ca<sup>2+</sup>、Zn<sup>2+</sup>、Mn<sup>2+</sup>、K<sup>+</sup>、Na<sup>+</sup>またはAl<sup>3+</sup>が、酢酸マグネシウム、塩化マグネシウム、リン酸マグネシウム、硫酸マグネシウム、酢酸カルシウム、塩化カルシウム、リン酸カルシウム、硫酸カルシウム、酢酸亜鉛、塩化亜鉛、リン酸亜鉛、硫酸亜鉛、酢酸マンガン、塩化マンガン、リン酸マンガン、硫酸マンガン、酢酸カリウム、塩化カリウム、リン酸カリウム、硫酸カリウム、酢酸ナトリウム、塩化ナトリウム、リン酸ナトリウム、硫酸ナトリウム、酢酸アルミニウム、塩化アルミニウム、リン酸アルミニウムまたは硫酸アルミニウムとして提供される、項目42または43に記載の薬学的組成物。

## (項目45)

前記作用物質が立体障害型一級アミンである、項目42に記載の薬学的組成物。

## (項目46)

前記立体障害型一級アミンがアミノ酸である、項目45に記載の薬学的組成物。

## (項目47)

前記アミノ酸が天然に存在するアミノ酸、天然に存在しないアミノ酸、またはアミノ酸誘導体である、項目46に記載の薬学的組成物。

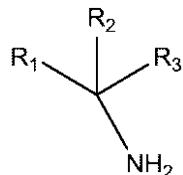
(項目48)

前記天然に存在するアミノ酸がヒスチジン、フェニルアラニン、アラニン、グルタミン酸、アスパラギン酸、グルタミン、ロイシン、メチオニン、アスパラギン、チロシン、トレオニン、イソロイシン、トリプトファンもしくはバリンであり、前記天然に存在しないアミノ酸が1-アミノシクロヘキサンカルボン酸、ランタニンもしくはテアニンである、項目47に記載の薬学的組成物。

(項目49)

前記立体障害型一級アミンが式：

【化11】



を有し、ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>が、H、C(O)OH、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルエーテル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオエーテル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボン酸、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボキシリルアミドおよびアルキルアリールから独立して選択され、ここで、任意の基がハロゲンまたはアミノによって単独でまたは多重に置換されてよく、ここで、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>の1つ以下がHである、項目42に記載の薬学的組成物。

(項目50)

前記立体障害型一級アミンがシクロヘキシリルアミンまたは2-メチルブチルアミンである、項目49に記載の薬学的組成物。

(項目51)

前記立体障害型一級アミンが重合アミンである、項目42に記載の薬学的組成物。

(項目52)

前記重合アミンがキトサンである、項目51に記載の薬学的組成物。

(項目53)

Mg<sup>2+</sup>、Ca<sup>2+</sup>、Zn<sup>2+</sup>、Mn<sup>2+</sup>、K<sup>+</sup>、Na<sup>+</sup>またはAl<sup>3+</sup>をさらに含むものである、項目45～52のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

(項目54)

前記Mg<sup>2+</sup>、Ca<sup>2+</sup>、Zn<sup>2+</sup>、Mn<sup>2+</sup>、K<sup>+</sup>、Na<sup>+</sup>またはAl<sup>3+</sup>が、酢酸マグネシウム、塩化マグネシウム、リン酸マグネシウム、硫酸マグネシウム、酢酸カルシウム、塩化カルシウム、リン酸カルシウム、硫酸カルシウム、酢酸亜鉛、塩化亜鉛、リン酸亜鉛、硫酸亜鉛、酢酸マンガン、塩化マンガン、リン酸マンガン、硫酸マンガン、酢酸カリウム、塩化カリウム、リン酸カリウム、硫酸カリウム、酢酸ナトリウム、塩化ナトリウム、リン酸ナトリウム、硫酸ナトリウム、酢酸アルミニウム、塩化アルミニウム、リン酸アルミニウムまたは硫酸アルミニウムとして提供される、項目50に記載の薬学的組成物。

(項目55)

抗酸化剤をさらに含む、項目42～54のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

(項目56)

前記抗酸化剤がBHA、ビタミンEまたは没食子酸プロピルである、項目55に記載の薬学的組成物。

(項目57)

薬学的に許容される結合剤または添加剤をさらに含む、項目42～56のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

## (項目 5 8 )

前記薬学的に許容される結合剤または添加剤が、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン（ポビドン）、デンプン、マルトデキストリンまたはセルロースエーテルから選択される、項目 5 7 に記載の薬学的組成物。

## (項目 5 9 )

前記薬学的に許容される結合剤または添加剤がポリビニルアルコールである、項目 5 8 に記載の薬学的組成物。

## (項目 6 0 )

前記薬学的に許容される結合剤または添加剤がセルロースエーテルである、項目 5 9 に記載の薬学的組成物。

## (項目 6 1 )

前記セルロースエーテルがメチルセルロース、エチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシエチルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロースおよびヒドロキシプロピルメチルセルロースから選択される、項目 6 0 に記載の薬学的組成物。

## (項目 6 2 )

薬学的に許容される充填剤をさらに含む、項目 4 2 ~ 6 1 のいずれかに記載の薬学的組成物。

## (項目 6 3 )

前記薬学的に許容される充填剤が、セルロース、イソマルト、マンニトール、ラクトースまたは第二リン酸カルシウムである、項目 6 2 に記載の薬学的組成物。

## (項目 6 4 )

前記セルロースが微細セルロースおよび微結晶性セルロースから選択される、項目 6 3 に記載の薬学的組成物。

## (項目 6 5 )

追加の治療薬をさらに含む、項目 4 1 ~ 6 4 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

## (項目 6 6 )

前記追加の治療薬が、鎮痛剤、抗うつ薬、作動促進剤もしくは運動促進剤、制吐剤、抗生素質、プロトンポンプインヒビター、酸遮断薬、P D E 5 インヒビター、酸ポンプアンタゴニスト、G A B A - B アゴニスト、胆汁酸隔離剤または粘膜保護剤の 1 つまたは複数から選択される、項目 6 5 に記載の薬学的組成物。

## (項目 6 7 )

項目 4 1 ~ 6 7 のいずれか一項に記載の薬学的組成物を含む投薬単位。

## (項目 6 8 )

カプセルまたは錠剤である、項目 6 7 に記載の投薬単位。

## (項目 6 9 )

項目 6 9 に記載の投薬単位であって、該投薬単位の各々が 5  $\mu$  g ~ 1 m g の前記ペプチドを含む、投薬単位。

## (項目 7 0 )

項目 4 1 ~ 6 9 のいずれか一項に記載の薬学的組成物を投与する工程を含む、胃腸障害を処置するための方法。

## (項目 7 1 )

前記胃腸障害が、胃不全麻痺、術後胃イレウス、機能性食道障害、機能性胃十二指腸障害、胃食道逆流性疾患（G E R D ）、セリック病、粘膜炎または十二指腸潰瘍もしくは胃潰瘍である、項目 7 0 に記載の方法。

## (項目 7 2 )

前記胃腸障害が胃不全麻痺である、項目 7 1 に記載の方法。

## (項目 7 3 )

前記胃不全麻痺が特発性、糖尿病性または術後の胃不全麻痺である、項目 7 2 に記載の方法。

(項目74)

前記胃腸障害が術後胃イレウスである、項目71に記載の方法。

(項目75)

前記胃腸障害が機能性食道障害である、項目71に記載の方法。

(項目76)

前記機能性食道障害が、機能性胸やけ、食道起源と推定される機能性胸痛、機能性嚥下障害または食道球である、項目75に記載の方法。

(項目77)

前記胃腸障害が機能性胃十二指腸障害である、項目71に記載の方法。

(項目78)

前記機能性胃十二指腸障害が、機能性消化不良、おくび障害、吐き気もしくは嘔吐障害、または反芻症候群である、項目77に記載の方法。

(項目79)

前記機能性消化不良が食後愁訴症候群または上腹部痛症候群である、項目78に記載の方法。

(項目80)

前記おくび障害が空気嚥下または特徴付けられていない過度のおくびである、項目78に記載の方法。

(項目81)

前記吐き気もしくは嘔吐障害が、慢性特発性の吐き気、機能性嘔吐または周期性嘔吐症候群である、項目78に記載の方法。

(項目82)

前記胃腸障害が胃食道逆流性疾患(GERD)である、項目71に記載の方法。

(項目83)

前記胃腸障害が十二指腸潰瘍または胃潰瘍である、項目71に記載の方法。

### 【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

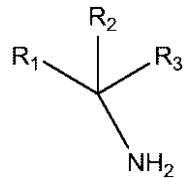
【訂正対象項目名】0083

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0083】

【化7】



を有し、式中、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>は、H、C(O)OH、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルエーテル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオエーテル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボン酸、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボキシルアミドおよびアルキルアリールから独立して選択され、任意の基がハロゲンまたはアミノによって単独でまたは多重に置換されてもよく、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>の2つ以下がHである。別の実施形態では、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>の1つしかHでない。