

【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27年8月20日(2015.8.20)

【公表番号】特表2015-516983(P2015-516983A)
 【公表日】平成27年6月18日(2015.6.18)
 【年通号数】公開・登録公報2015-039
 【出願番号】特願2015-509095(P2015-509095)
 【国際特許分類】

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 K 7/06 Z N A

【手続補正書】
 【提出日】平成27年6月30日(2015.6.30)
 【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】
 式 I:

Ala-Xaa₁-Pro-Gly-Xaa₂-Leu-Val (式 I)

で示されるアミノ酸配列を含む PAR4 アゴニストペプチドであって、
 該ペプチドのアミノ末端は遊離型であり;

Xaa₁ は Tyr または Phe(4-F) から選択され;

Xaa₂ は、Trp(5-OH)、(D,L)-Trp(5-Br)、D-Trp、Trp、Bzt、Tpi、His、Tza、3-Thi、3-Fur、His(Bzl)、Phe、Tyr、Phe(ペンタ-F)、2-Pya、3-Pya、4-Pya、Dpa、3-Pya(4-トリル)、Bip(2-メチル)、1-ナフチル-Ala、2-ナフチル-Ala、Tyr(Bzl) または スチリル-Ala から選択され;そして、

該 C-末端はアミド化されている、
 該 PAR4 アゴニストペプチド。

【請求項 2】

Xaa₁ が Phe(4-F) である、請求項 1 に記載の PAR4 アゴニストペプチド。

【請求項 3】

Xaa₂ が Trp である、請求項 2 に記載の PAR4 アゴニストペプチド。

【請求項 4】

配列番号 3 のアミノ酸配列を含む PAR4 アゴニストペプチド。

【請求項 5】

さらに Val の後に Lys を含む、請求項 1 に記載の PAR4 アゴニストペプチド。

【請求項 6】

さらに Val の後に Lys-Asn を含む、請求項 1 に記載の PAR4 アゴニストペプチド。

【請求項 7】

さらに Val の後に Lys-Asn-Gly を含む、請求項 1 に記載の PAR4 アゴニストペプチド。

【請求項 8】

式 I:

Ala-Xaa₁-Pro-Gly-Xaa₂-Leu-Val (式 I)

で示されるアミノ酸配列を含むペプチドであって、

該ペプチドのアミノ末端はアミノ酸に結合しておらず;

Xaa₁は、TyrおよびPhe(4-F)からなる群から選択され;

Xaa₂は、Trp(5-OH)、(D,L)-Trp(5-Br)、Trp、D-Trp、Bzt、Tpi、His、Tza、3-Thi、3-Fur、His(Bzl)、Phe、Tyr、Phe(ペンタ-F)、2-Pya、3-Pya、4-Pya、Dpa、3-Pya(4-トリル)、Bip(2-メチル)、1-ナフチル-Ala、2-ナフチル-Ala、Tyr(Bzl)およびスチリル-Alaからなる群から選択され;そして、

該ペプチドはPAR4アゴニスト活性を有する、
該ペプチド。

【請求項 9】

Xaa₁がPhe(4-F)である、請求項 8 に記載のペプチド。

【請求項 10】

Xaa₂がTrpである、請求項 8 に記載のペプチド。

【請求項 11】

配列番号3のアミノ酸配列を含むペプチド。

【請求項 12】

該アミノ酸配列がさらにValの後にLysを含む、請求項 8 ~ 10 のいずれか一項に記載のペプチド。

【請求項 13】

該アミノ酸配列がさらにValの後にLys-Asnを含む、請求項 8 ~ 10 のいずれか一項に記載のペプチド。

【請求項 14】

該アミノ酸配列がさらにValの後にLys-Asn-Glyを含む、請求項 8 ~ 10 のいずれか一項に記載のペプチド。

【請求項 15】

該アミノ酸配列から実質的に成るか、または成る、請求項 8 ~ 14 のいずれか一項に記載のペプチド。

【請求項 16】

該C-末端がアミド化されている、請求項 8 ~ 15 のいずれか一項に記載のペプチド。

【請求項 17】

PAR4受容体を活性化する、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載のPAR4アゴニストペプチドまたは請求項 8 ~ 16 のいずれか一項に記載のペプチド。

【請求項 18】

該PAR4受容体活性化が血小板凝集アッセイ、FLIPRアッセイ、またはその両方によって測定される、請求項 17 に記載のPAR4アゴニストペプチド。

【請求項 19】

該PAR4受容体活性化が配列番号1から成るペプチドによるPAR4受容体活性化よりも高い、請求項 17 または 18 に記載のPAR4アゴニストペプチドまたはペプチド。

【請求項 20】

該PAR4受容体活性化が、配列番号1から成るペプチドによるPAR4受容体活性化よりも、少なくとも約10倍、少なくとも約20倍、少なくとも約30倍、少なくとも約40倍、少なくとも約50倍、少なくとも約60倍、少なくとも約70倍、少なくとも約80倍、少なくとも約90倍、少なくとも約100倍、または少なくとも約110倍高い、請求項 19 に記載のPAR4アゴニストペプチドまたはペプチド。