

【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 07 K 7/06 (2006.01)

【F I】

C 07 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。