

【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25年8月1日(2013.8.1)

【公表番号】特表2012-529444(P2012-529444A)

【公表日】平成24年11月22日(2012.11.22)

【年通号数】公開・登録公報2012-049

【出願番号】特願2012-514348(P2012-514348)

【国際特許分類】

C 0 7 K	7/64	(2006.01)
C 0 7 K	7/50	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	7/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/18	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)

【F I】

C 0 7 K	7/64	Z N A
C 0 7 K	7/50	
A 6 1 K	37/02	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	7/12	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	17/18	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	43/00	

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 17/06

## 【手続補正書】

【提出日】平成25年6月11日(2013.6.11)

## 【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:

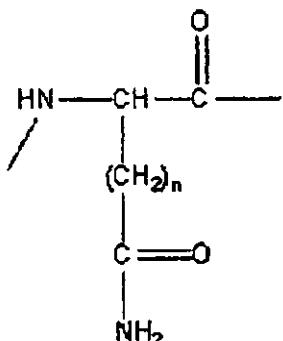
シクロ [ Arg<sup>1</sup> - Arg<sup>2</sup> - Pro<sup>3</sup> - Pro<sup>4</sup> - Tyr<sup>5</sup> - (Arg<sup>6</sup>)<sub>m</sub> - X<sup>7</sup> ] (I)

{式中、

mは、0又は1であり；

X<sup>7</sup>は、Asn、又は以下の式：

## 【化1】



(式中、nは、0、2、又は6である)

で表されるG1X基から選択され；そして、

X<sup>7</sup>は、該ペプチド又はペプチド模倣化合物を環化するようにペプチド結合を介してArg<sup>1</sup>に連結される)

で表される環状ペプチド又は環状ペプチド模倣化合物、あるいは

以下の位置の1つで式Iとは異なる化合物であって、それにより、式Iと異なっている場合、

Arg<sup>1</sup>の位置にある残基は、Lys又はHisによって置換され；又はArg<sup>2</sup>の位置にある残基は、Lys又はHisによって置換され；又はArg<sup>6</sup>の位置にある残基は、Lys又はHisによって置換され；又はTyr<sup>5</sup>の位置にある残基は、Trp、ナフチルアラニン、Phe、Met、Val、Ile又はLeuによって置換される化合物、

あるいは、そのレトロ類似体又はその医薬として許容される塩。

## 【請求項2】

位置Arg<sup>1</sup>で変化を含み、この場合、該残基はLys又はHisに置換される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項3】

位置Arg<sup>2</sup>で変化を含み、この場合、該残基はLys又はHisに置換される、請求

項1に記載の化合物。

【請求項4】

位置A<sub>rg</sub><sup>6</sup>で変化を含み、この場合、該残基はLys又はHisに置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

位置Tyr<sup>5</sup>で変化を含み、この場合、該残基はTrp、ナフチルアラニン、Phe、Met、Val、Leu又はLeuに置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

シクロ(RRPPYQ)、シクロ(RRPPYRQ)、シクロ(RRPPYN)、シクロ(RRPPWN)、又はそのレトロ類似体である請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬として許容される塩。

【請求項7】

請求項1～6のいずれか1項に記載の1以上の化合物及び薬学的担体を含む医薬組成物。

【請求項8】

前記組成物が経口投与可能である、請求項7に記載の医薬組成物。

【請求項9】

有効量の請求項1～6のいずれか1項に記載のペプチドを細胞の集団に投与し、それにより、細胞間のギャップ結合コミュニケーションを調節することを含む、細胞の集団におけるギャップ結合コミュニケーションを調節するインピトロにおける方法。

【請求項10】

治療に使用するための、請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項11】

治療法が、循環器疾患、気道上皮炎、肺胞組織障害、聽覚障害、内皮病変、糖尿病性網膜症、糖尿病性神経障害、中枢神経系虚血、脊髄虚血、歯組織障害、骨粗鬆症、腎臓病、骨髄移植不全、外傷、勃起障害、尿失禁、神経障害性疼痛、亜慢性及び慢性炎症、癌、移植不全；乾癬及び過剰な反応性酸素種及び／又はフリー・ラジカル及び／又は一酸化窒素を原因とした皮膚疾患から成る群から選択される、治療方法に利用するための請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項12】

機能低下したギャップ結合コミュニケーションに関わる病態を治療するための薬剤の製造における、請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項13】

患者がヒトである、請求項1～2に記載の使用。

【請求項14】

病態が、循環器疾患、気道上皮炎、肺胞組織障害、聽覚障害、内皮病変、糖尿病性網膜症、糖尿病性神経障害、中枢神経系虚血、脊髄虚血、歯組織障害、骨粗鬆症、腎臓病、骨髄移植不全、外傷、勃起障害、尿失禁、神経障害性疼痛、亜慢性及び慢性炎症、癌、移植不全；乾癬及び過剰な反応性酸素種及び／又はフリー・ラジカル及び／又は一酸化窒素を原因とした皮膚疾患から成る群から選択される、請求項1～2又は1～3に記載の使用。