

【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24年5月17日(2012.5.17)

【公表番号】特表2010-522769(P2010-522769A)

【公表日】平成22年7月8日(2010.7.8)

【年通号数】公開・登録公報2010-027

【出願番号】特願2010-501238(P2010-501238)

【国際特許分類】

C 07 K	2/00	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	31/12	(2006.01)
A 61 P	31/18	(2006.01)
A 61 P	33/00	(2006.01)
A 61 P	23/00	(2006.01)
A 61 P	7/02	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)
A 61 P	25/20	(2006.01)
A 61 P	25/04	(2006.01)
A 61 P	15/16	(2006.01)
A 61 P	15/18	(2006.01)
A 61 P	5/00	(2006.01)
A 61 P	27/06	(2006.01)
A 61 P	27/02	(2006.01)
A 61 P	25/24	(2006.01)
A 61 P	25/18	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	25/22	(2006.01)
A 61 P	25/08	(2006.01)
A 61 P	21/02	(2006.01)
A 61 P	25/16	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)
A 61 P	7/00	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	9/12	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 K	38/00	(2006.01)

【F I】

C 07 K	2/00	Z N A
A 61 P	35/00	
A 61 P	31/04	
A 61 P	31/12	
A 61 P	31/18	
A 61 P	33/00	
A 61 P	23/00	
A 61 P	7/02	
A 61 P	29/00	
A 61 P	37/06	

A 6 1 P 25/20  
 A 6 1 P 25/04  
 A 6 1 P 15/16  
 A 6 1 P 15/18  
 A 6 1 P 5/00  
 A 6 1 P 27/06  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/08  
 A 6 1 P 21/02  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 21/00  
 A 6 1 P 7/00  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 43/00 1 0 1  
 A 6 1 K 37/02

## 【手続補正書】

【提出日】平成23年3月28日(2011.3.28)

## 【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

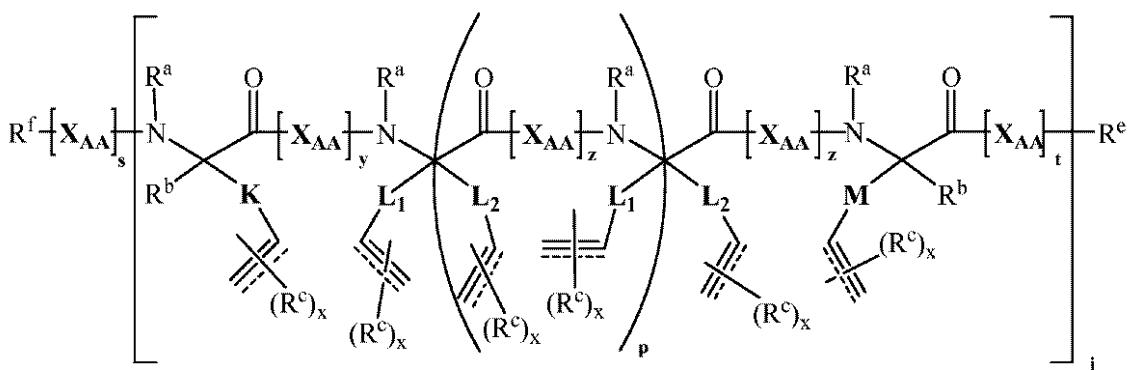
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式:

## 【化84】



を有する、実質的にらせんのポリペプチドであって、式中、

K、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>およびMは、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；

くは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンであり；

$R^a$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシルであるか；または  $R^a$  は、適切なアミノ保護基であり；

$R^b$  は、それぞれの場合、独立して、適切なアミノ酸側鎖；水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

$R^c$  は、それぞれの場合、独立して、水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

$R^e$  は、それぞれの場合、独立して、 $-R^E$ 、 $-OR^E$ 、 $-N(R^E)_2$  または  $-SR^E$  であり、 $R^E$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なヒドロキシル保護基、アミノ保護基またはチオール保護基であるか；または 2 個の  $R^E$  基で、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$R^f$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なアミノ保護基；場合によりリンカーで接続されている標識であり、該リンカーは、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンから選択されるか；または  $R^f$  と  $R^a$  とで、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$X_{AA}$  は、それぞれの場合、独立して、天然アミノ酸または非天然アミノ酸であり；

$x$  は、それぞれの場合、独立して、0～3 の整数であり；

$y$  および  $z$  は、それぞれの場合、独立して、2～6 の整数であり；

$j$  は、独立して、1～10 の整数であり；

$p$  は、0～10 の整数であり；

$s$  および  $t$  は、それぞれの場合、独立して、0～100 の整数であり；

【化 8 5】

---



---

は、二重結合または三重結合に対応し、

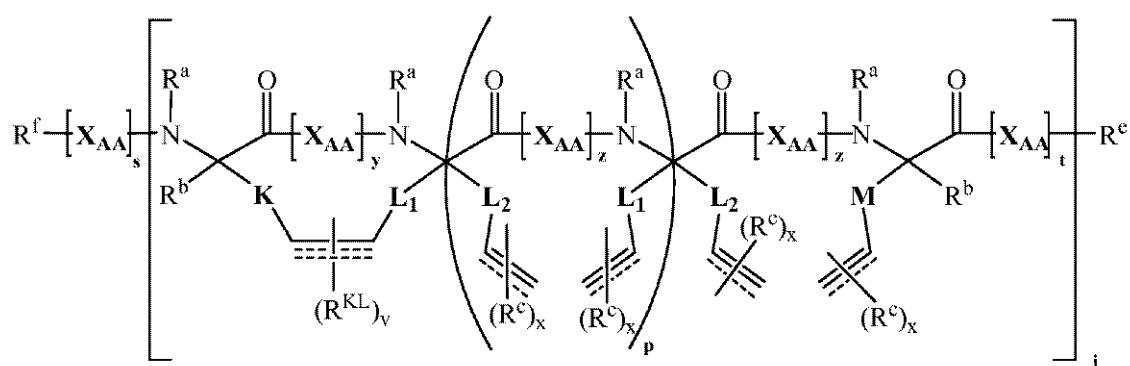
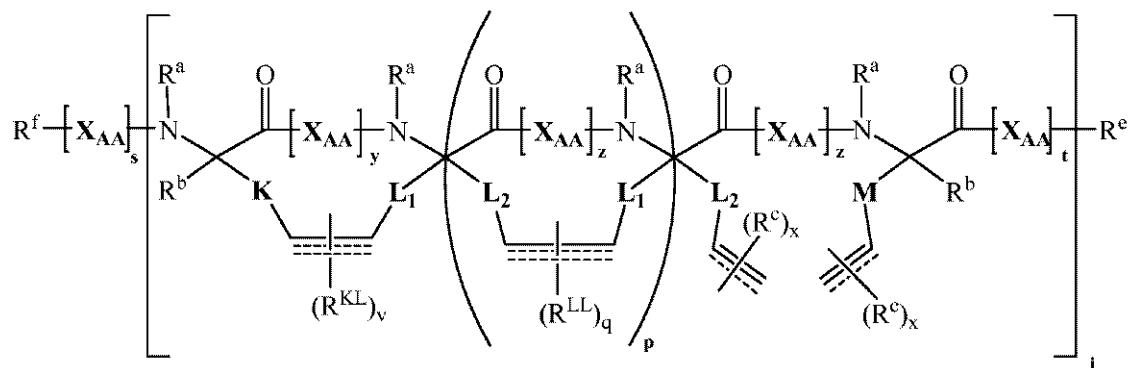
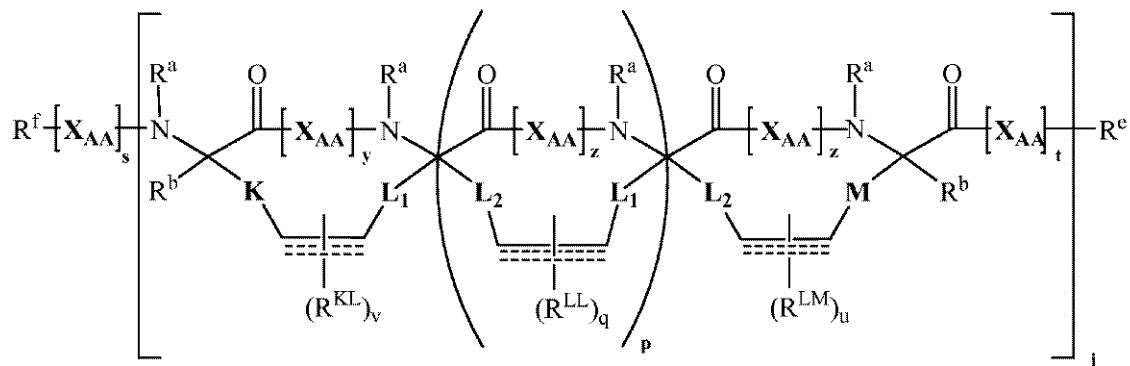
L<sub>1</sub>が結合の場合、L<sub>2</sub>は結合ではなく、またはL<sub>2</sub>が結合の場合、L<sub>1</sub>は結合ではない

、  
ポリペプチド。

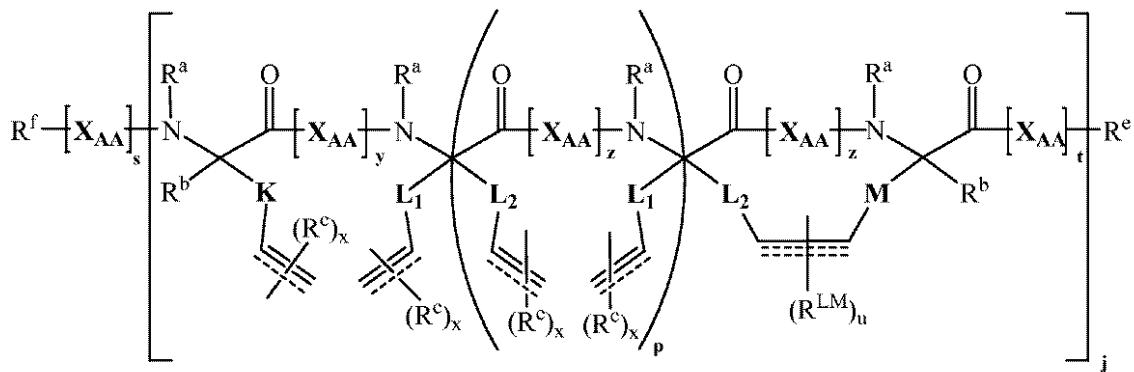
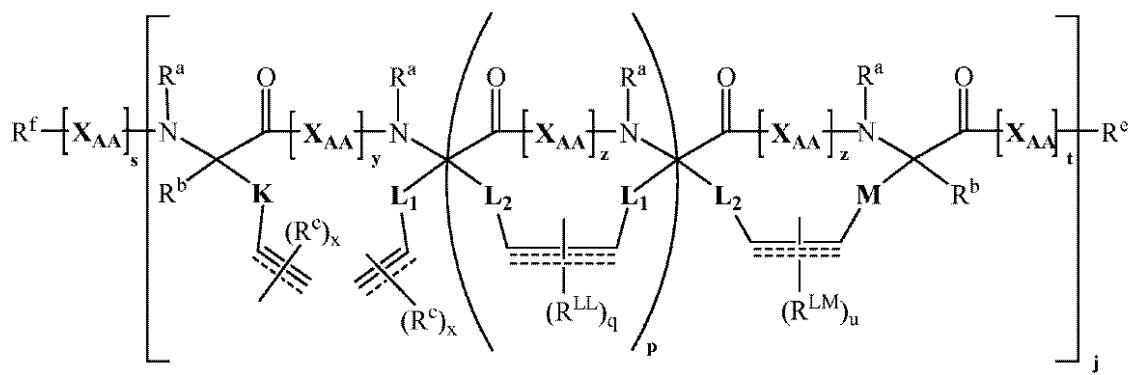
【請求項 2】

式：

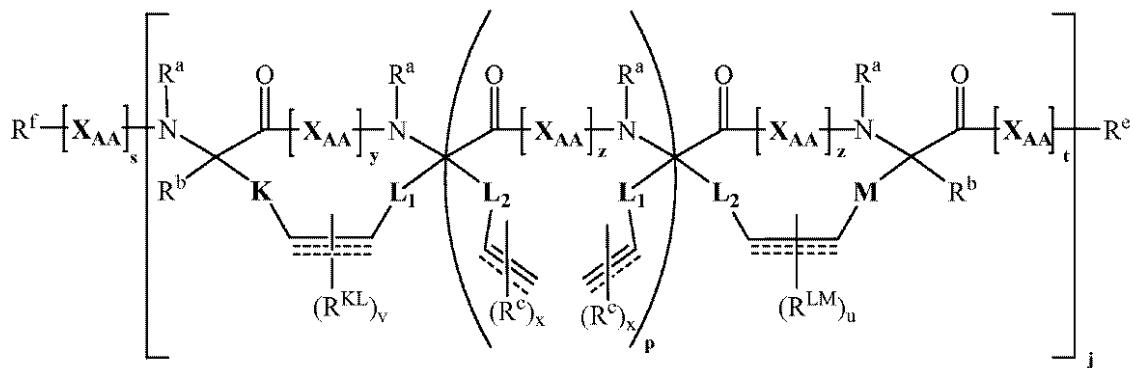
【化 8 6】



【化 8 7】



または



を有する、実質的にらせんのポリペプチドであって、式中、

$\text{K}$ 、 $\text{L}_1$ 、 $\text{L}_2$ および $\text{M}$ は、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンであり；

$\text{R}^a$ は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシルであるか；または $\text{R}^a$ は、適切なアミノ保護基であり；

$R^b$  は、それぞれの場合、独立して、適切なアミノ酸側鎖；水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシリル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

$R^c$  は、それぞれの場合、独立して、水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシリル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

$R^e$  は、それぞれの場合、独立して、 $-R^E$ 、 $-OR^E$ 、 $-N(R^E)_2$  または  $-SR^E$  であり、 $R^E$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なヒドロキシリル保護基、アミノ保護基またはチオール保護基であるか；または 2 個の  $R^E$  基で、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$R^f$  は、それぞれの場合、独立して、水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なアミノ保護基；場合によりリンカーで接続されている標識であり、該リンカーは、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンから選択され；または  $R^f$  と  $R^a$  とで、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$R^{K^L}$ 、 $R^{L^L}$  および  $R^{L^M}$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシリル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；アジド；シアノ；イソシアノ；ハロ；ニトロであるか；

または 2 個の隣接する  $R^{K^L}$  基が結合して、置換もしくは非置換の 5 員環～8 員環の脂環式環；置換もしくは非置換の 5 員環～8 員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成するか；2 個の隣接する  $R^{K^L}$  基が結合して、置換もしくは非置換の 5～8 員環の脂環式環；置換もしくは非置換の 5～8 員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成するか；または 2 個の隣接する  $R^{L^M}$  基が結合して、置換もしくは非置換の 5～8 員環の脂環式環；置換もしくは非置換の 5～8 員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成し；

$X_{AA}$  は、それぞれの場合、独立して、天然アミノ酸または非天然アミノ酸であり；

$x$  は、それぞれの場合、独立して、0～3 の整数であり；

$y$  は 2 であり、 $z$  は 3 である、または  $y$  は 2 であり、 $z$  は 5 である、または  $y$  は 2 であ

り、 $z$  は 6 である、または  $y$  は 3 であり、 $z$  は 2 である、または  $y$  は 3 であり、 $z$  は 3 である、または  $y$  は 3 であり、 $z$  は 5 である、または  $y$  は 3 であり、 $z$  は 6 である、または  $y$  は 5 であり、 $z$  は 2 である、または  $y$  は 5 であり、 $z$  は 3 である、または  $y$  は 5 であり、 $z$  は 6 である、または  $y$  は 6 であり、 $z$  は 2 である、または  $y$  は 6 であり、 $z$  は 3 である、または  $y$  は 6 であり、 $z$  は 5 であり、

$j$  は、それぞれの場合、独立して、1 ~ 10 の整数であり；

$p$  は、それぞれの場合、0 ~ 10 の整数であり；

$s$  および  $t$  は、それぞれの場合、独立して、0 ~ 100 の整数であり；

$u$ 、 $v$  および  $q$  は、それぞれの場合、独立して、0 ~ 4 の整数であり；

【化 8 8】

---



---

は、二重結合または三重結合に対応し；

【化 8 9】

---



---

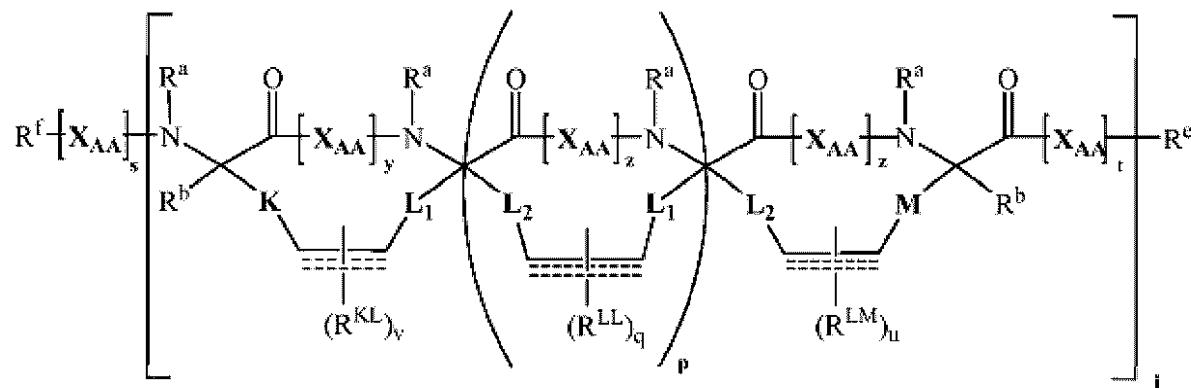
は、単結合、二重結合または三重結合に対応する、

ポリペプチド。

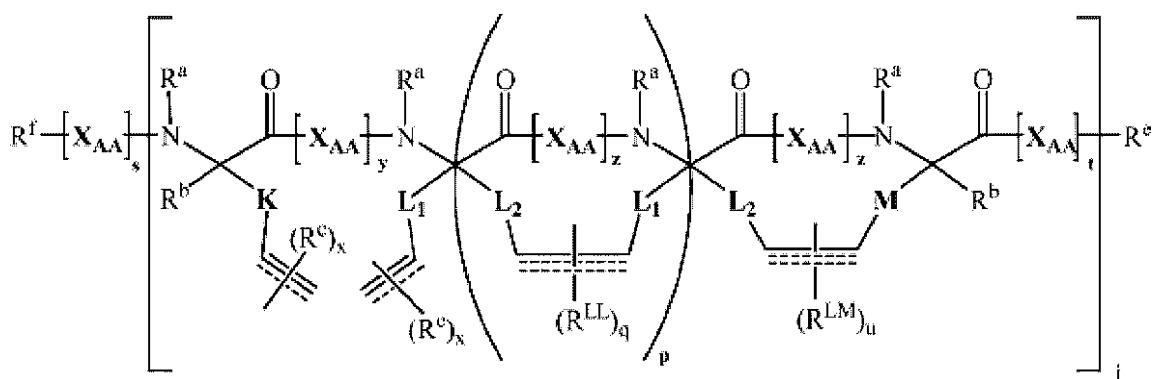
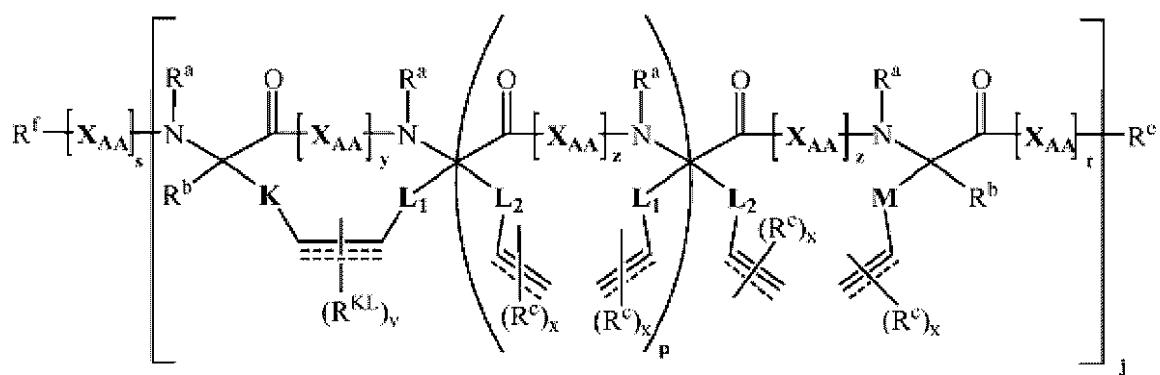
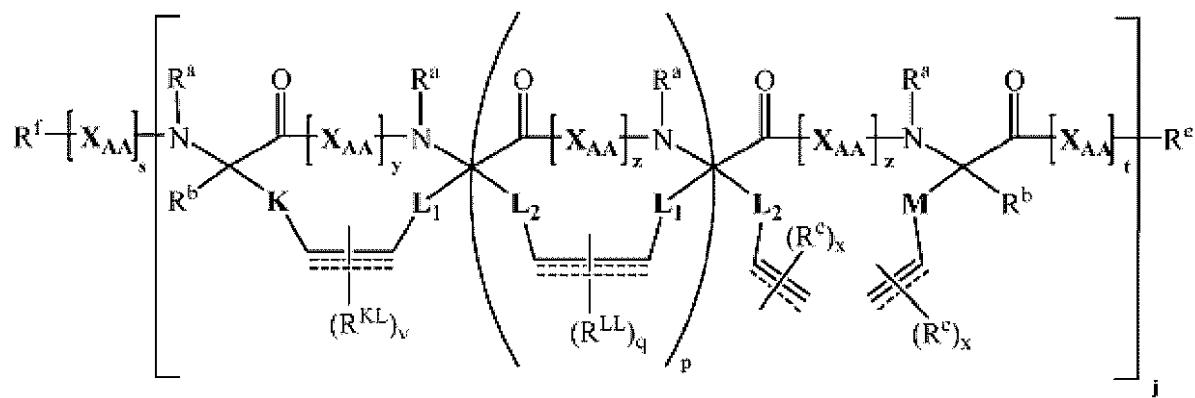
【請求項 3】

式：

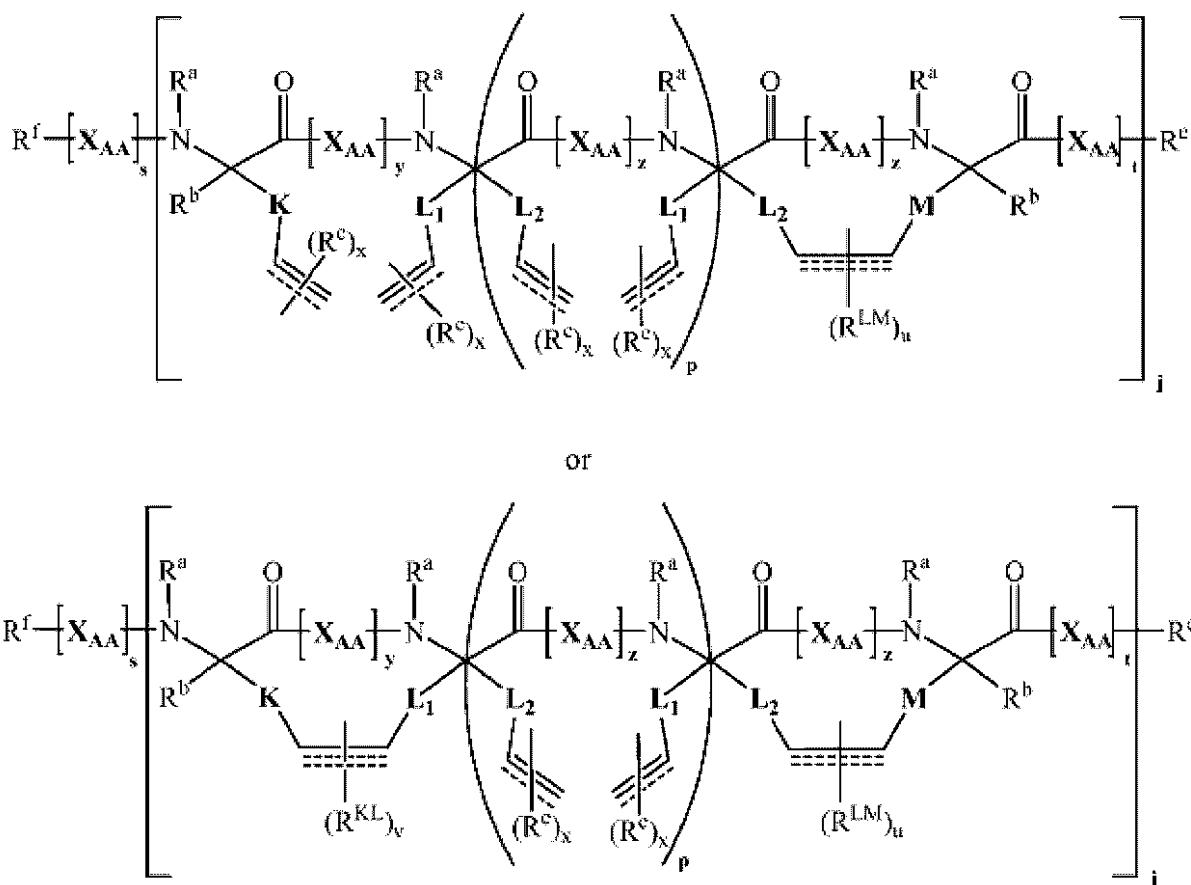
【化 8 6 - 1】



【化 8 6 - 2】



【化 8 6 - 3】



を有する、実質的にらせんのポリペプチドであって、式中、

K、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>およびMは、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンであり；

R<sup>a</sup>は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシルであるか；またはR<sup>a</sup>は、適切なアミノ保護基であり；

R<sup>b</sup>は、それぞれの場合、独立して、適切なアミノ酸側鎖；水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

R<sup>c</sup>は、それぞれの場合、独立して、水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒ

ドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

R<sup>E</sup>は、それぞれの場合、独立して、-R<sup>E</sup>、-OR<sup>E</sup>、-N(R<sup>E</sup>)<sub>2</sub>、または-SR<sup>E</sup>であり、R<sup>E</sup>は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なヒドロキシル保護基、アミノ保護基またはチオール保護基であるか；または2個のR<sup>E</sup>基で、置換もしくは非置換の5員環～6員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

R<sup>f</sup>は、それぞれの場合、独立して、水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なアミノ保護基；場合によりリンカーで接続されている標識であり、該リンカーは、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンから選択され；またはR<sup>f</sup>とR<sup>a</sup>とで、置換もしくは非置換の5員環～6員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

R<sup>KL</sup>、R<sup>Ll</sup>およびR<sup>LM</sup>は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；アジド；シアノ；イソシアノ；ハロ；ニトロであるか；

または2個の隣接するR<sup>KL</sup>基が結合して、置換もしくは非置換の5員環～8員環の脂環式環；置換もしくは非置換の5員環～8員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成するか；2個の隣接するR<sup>KL</sup>基が結合して、置換もしくは非置換の5～8員環の脂環式環；置換もしくは非置換の5～8員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成するか；または2個の隣接するR<sup>LM</sup>基が結合して、置換もしくは非置換の5～8員環の脂環式環；置換もしくは非置換の5～8員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成し；

X<sub>AA</sub>は、それぞれの場合、独立して、天然アミノ酸または非天然アミノ酸であり；

xは、それぞれの場合、独立して、0～3の整数であり；

yおよびzは、それぞれの場合、独立して、2～6の整数であり；

pは、それぞれの場合、独立して、0～10の整数であり；

sおよびtは、それぞれの場合、独立して、0～100の整数であり；

u、vおよびqは、それぞれの場合、独立して、0～4の整数であり；

【化88】

は、二重結合または三重結合に対応し；

## 【化 8 9】

は、二重結合または三重結合に対応し、

L<sub>1</sub>が結合の場合、L<sub>2</sub>は結合ではなく、またはL<sub>2</sub>が結合の場合、L<sub>1</sub>は結合ではない

ポリペプチド。

## 【請求項 4】

すべての

## 【化 9 0】

が、二重結合に対応する、請求項 1、2または3に記載のポリペプチド。

## 【請求項 5】

すべての

## 【化 9 1】

が、二重結合に対応する、請求項 2または3に記載のポリペプチド。

## 【請求項 6】

K、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>およびMは、独立して、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のC<sub>1</sub>～<sub>20</sub>アルキレンに対応する、請求項 1、2または3に記載のポリペプチド。

## 【請求項 7】

K、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>およびMは、独立して、式 - (CH<sub>2</sub>)<sub>g+1</sub> - に対応し、gは0～10である、請求項6に記載のポリペプチド。

## 【請求項 8】

L<sub>1</sub>が結合の場合、L<sub>2</sub>は結合ではなく、またはL<sub>2</sub>が結合の場合、L<sub>1</sub>は結合ではない、請求項 1、2または3に記載のポリペプチド。

## 【請求項 9】

R<sup>a</sup>が水素である、請求項 1、2または3に記載のポリペプチド。

## 【請求項 10】

R<sup>b</sup>が水素である、請求項 1、2または3に記載のポリペプチド。

## 【請求項 11】

R<sup>f</sup>が、場合によりリンカーで接続されている標識である、請求項 1、2または3に記載のポリペプチド。

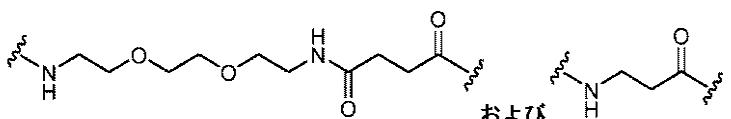
## 【請求項 12】

R<sup>f</sup>が、ヘテロアルキレンリンカーで接続されている標識である、請求項 11に記載のポリペプチド。

## 【請求項 13】

前記ヘテロアルキレンリンカーが、

## 【化 9 2】

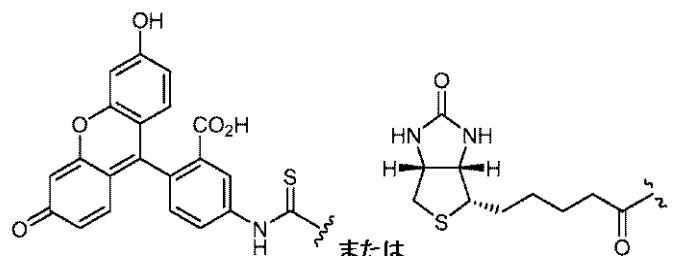


から選択される、請求項 12に記載のポリペプチド。

## 【請求項 14】

前記標識が

## 【化93】



から選択される、請求項12に記載のポリペプチド。

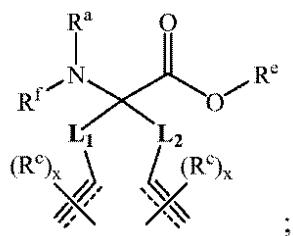
## 【請求項15】

前記ポリペプチドが、配列番号1～122のポリペプチドから選択される、請求項2ま  
たは3に記載のポリペプチド。

## 【請求項16】

(i) 式(A)：

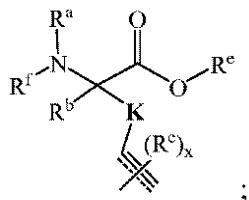
## 【化94】



のビス・アミノ酸を提供する工程と、

(ii) 式(B)：

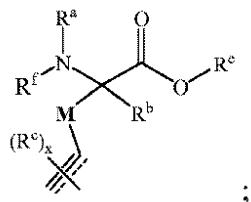
## 【化95】



のアミノ酸を提供する工程と、

(iii) 式(C)：

## 【化96】



のアミノ酸を提供する工程と、

(iv) 少なくとも1つのさらなるアミノ酸を提供する工程と；

(v) 式(A)、(B)および(C)のアミノ酸と、工程(iv)の少なくとも1つのアミノ酸とをカップリングさせ、式(I)のポリペプチドを得る工程とを含む、実質的にらせんのポリペプチドを製造する方法であって、

L<sub>1</sub>が結合の場合、L<sub>2</sub>は結合ではなく、またはL<sub>2</sub>が結合の場合、L<sub>1</sub>は結合ではない

方法。

## 【請求項17】

(v i) 工程 (v) のポリペプチドを触媒で処理する工程をさらに含む、請求項1\_6に記載の実質的にらせんのポリペプチドを製造する方法。

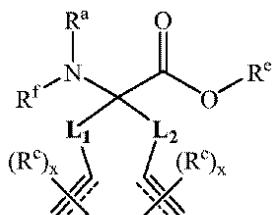
【請求項18】

前記触媒がルテニウム触媒である、請求項1\_7に記載の方法。

【請求項19】

式：

【化97】



を有するビス・アミノ酸であって、式中、

$L_1$  は、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；または置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンであり；

$L_2$  は、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンであり；

$R^a$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシルであるか；または  $R^a$  は、適切なアミノ保護基であり；

$R^c$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

$R^e$  は、それぞれの場合、独立して、 $-R^E$ 、 $-OR^E$ 、 $-N(R^E)_2$  または  $-SR^E$  であり、 $R^E$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なヒドロキシル保護基、アミノ保護基またはチオール保護基であるか；または 2 個の  $R^E$  基で、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$R^f$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしく

は非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なアミノ保護基であるか；またはR<sup>f</sup>とR<sup>a</sup>とで、置換もしくは非置換の5員環～6員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

xは、それぞれの場合、独立して、0～3の整数であり；

### 【化98】

---



---

は、二重結合または三重結合に対応し、

L<sub>1</sub>が結合の場合、L<sub>2</sub>は結合ではなく、またはL<sub>2</sub>が結合の場合、L<sub>1</sub>は結合ではないビス・アミノ酸。

### 【請求項20】

請求項2または3に記載の実質的にらせんのポリペプチドを含む医薬組成物。

### 【請求項21】

治療的に有効量の請求項2または3に記載の実質的にらせんのポリペプチドを含む、被験体の疾患、障害または状態を治療するための組成物。

### 【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0032

【補正方法】変更

【補正の内容】

### 【0032】

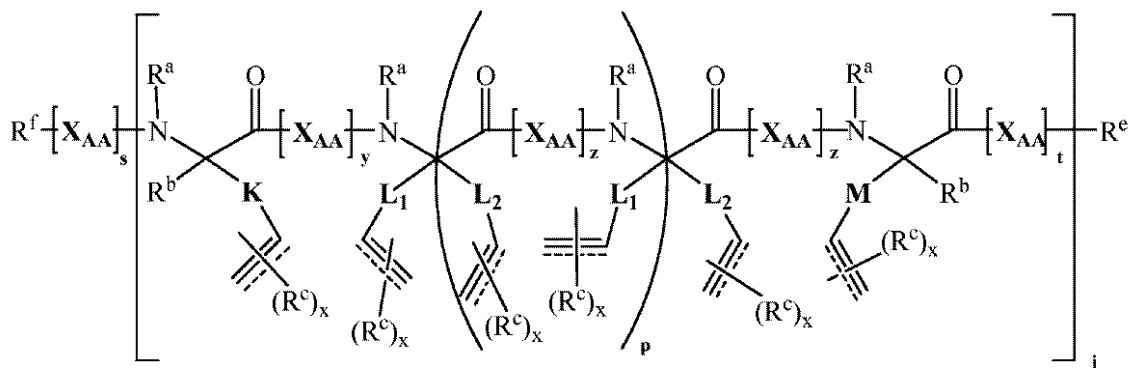
本発明の1つ以上の実施形態の詳細を、本明細書に記載している。本発明の他の特徴、目的および利点は、この記載、図面、実施例および特許請求の範囲から明らかである。

例えば、本発明は以下を提供する。

### (項目1)

式：

### 【化84】



を有する、実質的にらせんのポリペプチドであって、式中、

K、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>およびMは、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレ

ン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンであり；

$R^a$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシルであるか；または  $R^a$  は、適切なアミノ保護基であり；

$R^b$  は、それぞれの場合、独立して、適切なアミノ酸側鎖；水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

$R^c$  は、それぞれの場合、独立して、水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

$R^e$  は、それぞれの場合、独立して、 $-R^E$ 、 $-OR^E$ 、 $-N(R^E)_2$  または  $-SR^E$  であり、 $R^E$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なヒドロキシル保護基、アミノ保護基またはチオール保護基であるか；または 2 個の  $R^E$  基で、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$R^f$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なアミノ保護基；場合によりリンカーで接続されている標識であり、該リンカーは、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンから選択されるか；または  $R^f$  と  $R^a$  とで、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$X_{AA}$  は、それぞれの場合、独立して、天然アミノ酸または非天然アミノ酸であり；

$x$  は、それぞれの場合、独立して、0～3 の整数であり；

$y$  および  $z$  は、それぞれの場合、独立して、2～6 の整数であり；

$j$  は、独立して、1～10 の整数であり；

$p$  は、0～10 の整数であり；

$s$  および  $t$  は、それぞれの場合、独立して、0～100 の整数であり；

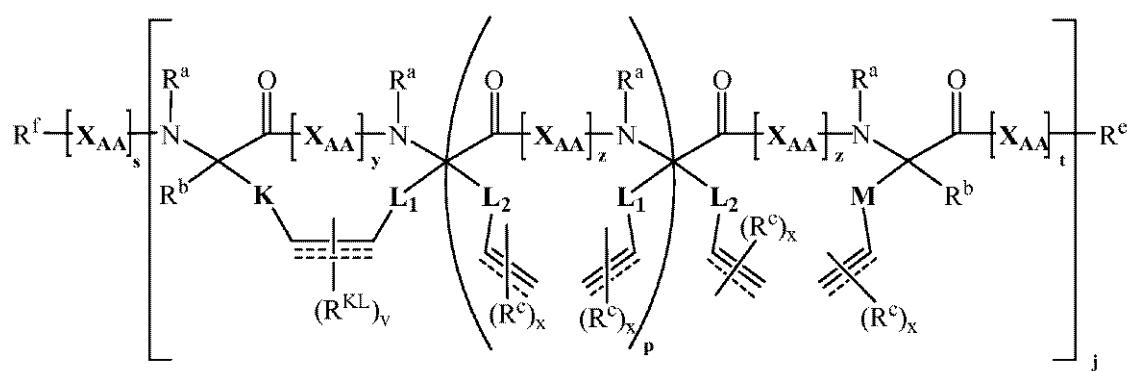
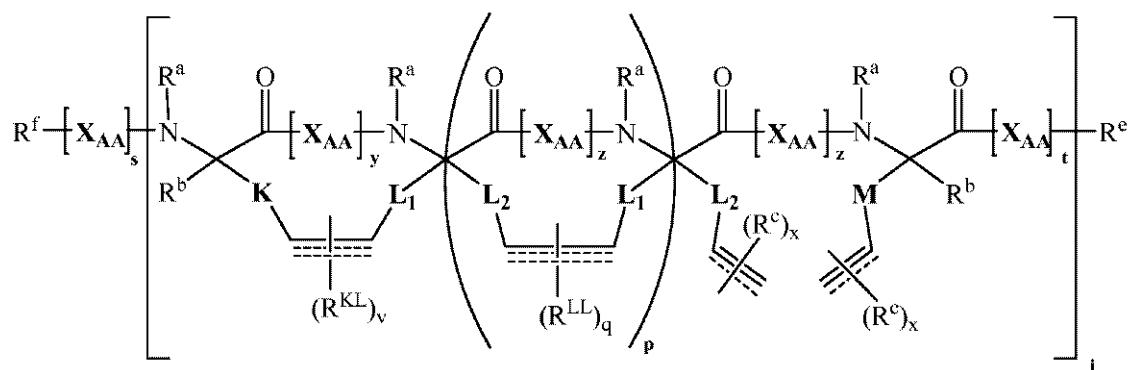
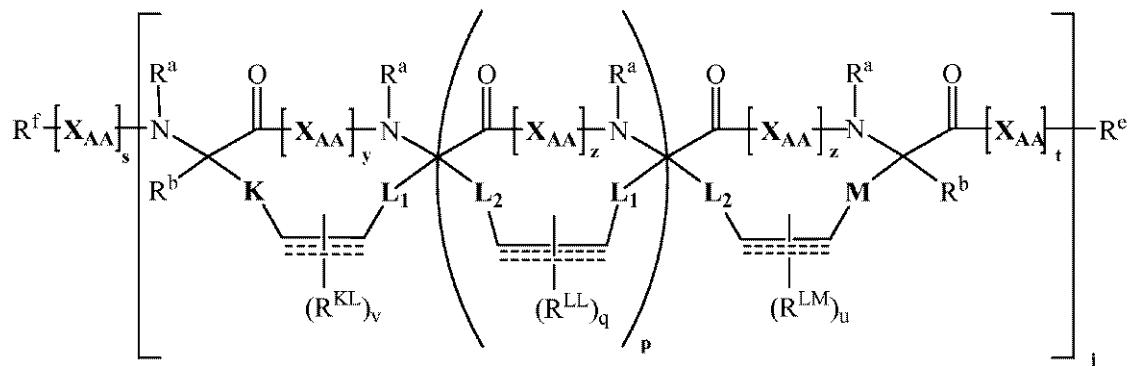
【化 8 5】

は、二重結合または三重結合に対応する、  
ポリペプチド。

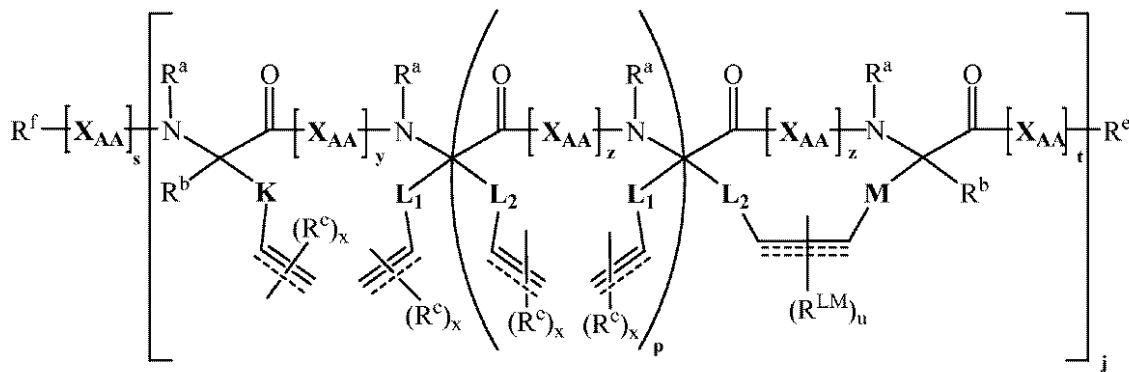
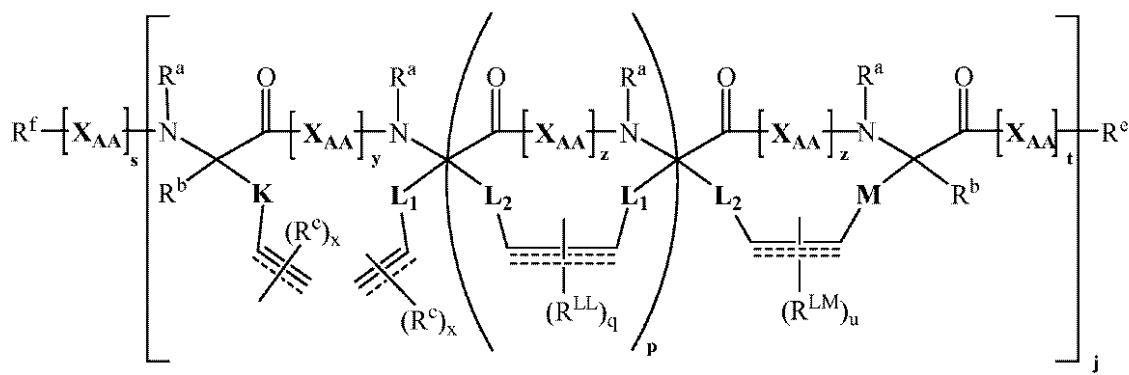
(項目2)

式:

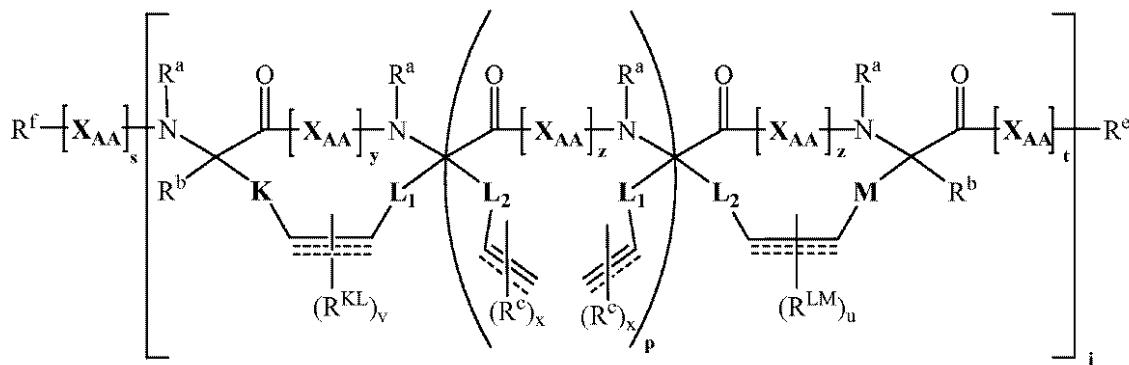
【化86】



【化 8 7】



または



を有する、実質的にらせんのポリペプチドであって、式中、

$K$ 、 $L_1$ 、 $L_2$ および $M$ は、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンであり；

$R^a$ は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシルであるか；または

$R^a$  は、適切なアミノ保護基であり；

$R^b$  は、それぞれの場合、独立して、適切なアミノ酸側鎖；水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシリル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

$R^e$  は、それぞれの場合、独立して、 $-R^E$ 、 $-OR^E$ 、 $-N(R^E)_2$  または  $-SR^E$  であり、 $R^E$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシリル；樹脂；適切なヒドロキシル保護基、アミノ保護基またはチオール保護基であるか；または 2 個の  $R^E$  基で、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$R^f$  は、それぞれの場合、独立して、水素；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシリル；樹脂；適切なアミノ保護基；場合によりリンカーで接続されている標識であり、該リンカーは、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンから選択され；または  $R^f$  と  $R^a$  とで、置換もしくは非置換の 5 員環～6 員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

$R^{K_L}$ 、 $R^{L_L}$  および  $R^{L_M}$  は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシリル；置換もしくは非置換のヒドロキシル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；アジド；シアノ；イソシアノ；ハロ；ニトロであるか；

または 2 個の隣接する  $R^{K_L}$  基が結合して、置換もしくは非置換の 5 員環～8 員環の脂環式環；置換もしくは非置換の 5 員環～8 員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成するか；2 個の隣接する  $R^{K_L}$  基が結合して、置換もしくは非置換の 5～8 員環の脂環式環；置換もしくは非置換の 5～8 員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成するか；または 2 個の隣接する  $R^{L_M}$  基が結合して、置換もしくは非置換の 5～8 員環の脂環式環；置換もしくは非置換の 5～8 員環のヘテロ脂環式環；置換もしくは非置換のアリール環；または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成し；

$X_{AA}$  は、それぞれの場合、独立して、天然アミノ酸または非天然アミノ酸であり；

$x$  は、それぞれの場合、独立して、0～3 の整数であり；

$y$  および  $z$  は、それぞれの場合、独立して、2～6 の整数であり；

$j$  は、それぞれの場合、独立して、1～10 の整数であり；

$p$  は、それぞれの場合、独立して、0～10 の整数であり；

$s$  および  $t$  は、それぞれの場合、独立して、0～100 の整数であり；

$u$ 、 $v$  および  $q$  は、それぞれの場合、独立して、0～4 の整数であり；

【化88】

は、二重結合または三重結合に対応し；

【化89】

は、単結合、二重結合または三重結合に対応する、

ポリペプチド。

(項目3)

すべての

【化90】

が、二重結合に対応する、項目1または2に記載のポリペプチド。

(項目4)

すべての

【化91】

が、単結合または二重結合に対応する、項目2に記載のポリペプチド。

(項目5)

K、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>およびMは、独立して、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のC<sub>1~20</sub>アルキレンに対応する、項目1または2に記載のポリペプチド。

(項目6)

K、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>およびMは、独立して、式-(CH<sub>2</sub>)<sub>g+1</sub>-に対応し、gは0~10である、項目5に記載のポリペプチド。

(項目7)

L<sub>1</sub>が結合の場合、L<sub>2</sub>は結合ではなく、またはL<sub>2</sub>が結合の場合、L<sub>1</sub>は結合ではない、項目1または2に記載のポリペプチド。

(項目8)

R<sup>a</sup>が水素である、項目1または2に記載のポリペプチド。

(項目9)

R<sup>b</sup>が水素である、項目1または2に記載のポリペプチド。

(項目10)

R<sup>f</sup>が、場合によりリンカーで接続されている標識である、項目1または2に記載のポリペプチド。

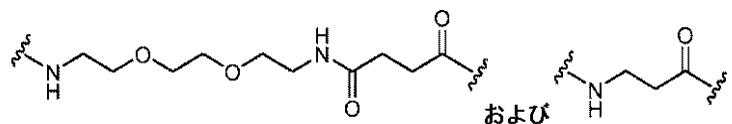
(項目11)

R<sup>f</sup>が、ヘテロアルキレンリンカーで接続されている標識である、項目10に記載のポリペプチド。

(項目12)

前記ヘテロアルキレンリンカーが、

## 【化92】

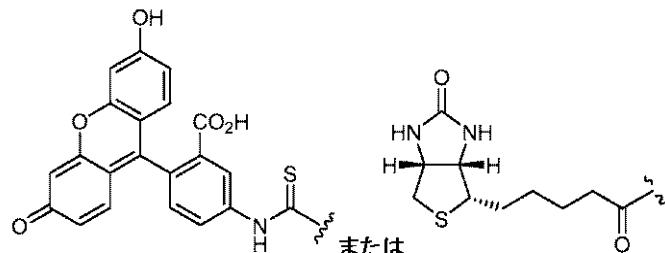


から選択される、項目11に記載のポリペプチド。

(項目13)

前記標識が

## 【化93】



から選択される、項目11に記載のポリペプチド。

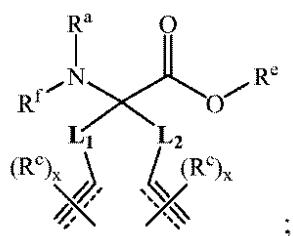
(項目14)

前記ポリペプチドが、配列番号1～122のポリペプチドから選択される、項目2に記載のポリペプチド。

(項目15)

(i)式(A)：

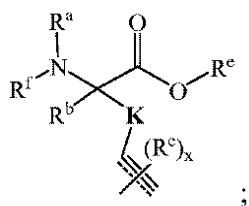
## 【化94】



のビス・アミノ酸を提供する工程と、

(ii)式(B)：

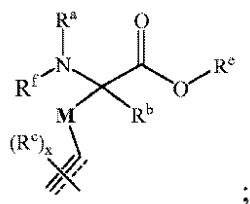
## 【化95】



のアミノ酸を提供する工程と、

(iii)式(C)：

## 【化96】



のアミノ酸を提供する工程と、

(i v) 少なくとも 1 つのさらなるアミノ酸を提供する工程と；

(v) 式 (A)、(B) および (C) のアミノ酸と、工程 (i v) の少なくとも 1 つのアミノ酸とをカップリングさせ、式 (I) のポリペプチドを得る工程とを含む、実質的にらせんのポリペプチドを製造する方法。

(項目 16)

(v i) 工程 (v) のポリペプチドを触媒で処理する工程をさらに含む、項目 3 に記載の実質的にらせんのポリペプチドを製造する方法。

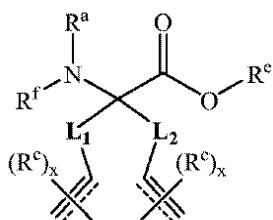
(項目 17)

前記触媒がガルテニウム触媒である、項目 16 に記載の方法。

(項目 18)

式：

## 【化97】



を有するビス - アミノ酸であって、式中、

L<sub>1</sub> は、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；置換もしくは非置換のアシレンであり；

L<sub>2</sub> は、それぞれの場合、独立して、結合であるか、または環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルケニレン；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロアルキニレン；置換もしくは非置換のアリーレン；置換もしくは非置換のヘテロアリーレン；または置換もしくは非置換のアシレンであり；

R<sup>a</sup> は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシルであるか；または

R<sup>a</sup>は、適切なアミノ保護基であり；

R<sup>c</sup>は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；環状もしくは非環状、置換もしくは非置換のアシル；置換もしくは非置換のヒドロキシリル；置換もしくは非置換のチオール；置換もしくは非置換のアミノ；シアノ；イソシアノ；ハロ；またはニトロであり；

R<sup>e</sup>は、それぞれの場合、独立して、-R<sup>E</sup>、-OR<sup>E</sup>、-N(R<sup>E</sup>)<sub>2</sub>または-SR<sup>E</sup>であり、R<sup>E</sup>は、それぞれの場合、独立して、水素であるか、環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なヒドロキシリル保護基、アミノ保護基またはチオール保護基であるか；または2個のR<sup>E</sup>基で、置換もしくは非置換の5員環～6員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

R<sup>f</sup>は、それぞれの場合、独立して、水素であるか；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換の脂肪族；環状もしくは非環状、分枝もしくは非分枝、置換もしくは非置換のヘテロ脂肪族；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のアシル；樹脂；適切なアミノ保護基であるか；またはR<sup>f</sup>とR<sup>a</sup>とで、置換もしくは非置換の5員環～6員環の複素環またはヘテロ芳香族環を形成し；

xは、それぞれの場合、独立して、0～3の整数であり；

【化98】

=====

は、二重結合または三重結合に対応する、

ビス・アミノ酸。

(項目19)

項目2に記載の実質的にらせんのポリペプチドを含む医薬組成物。

(項目20)

治療的に有効量の項目2に記載の実質的にらせんのポリペプチドを、処置の必要な被験体に投与する工程を含む、被験体の疾患、障害または状態を治療する方法。