

【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18年8月17日(2006.8.17)

【公表番号】特表2006-513141(P2006-513141A)

【公表日】平成18年4月20日(2006.4.20)

【年通号数】公開・登録公報2006-016

【出願番号】特願2004-530000(P2004-530000)

【国際特許分類】

C 07 K	5/02	(2006.01)
C 07 K	5/117	(2006.01)
C 07 K	7/02	(2006.01)
C 07 K	7/06	(2006.01)
C 12 P	21/02	(2006.01)
A 61 K	38/00	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	7/02	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	25/28	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	35/04	(2006.01)
A 61 P	37/02	(2006.01)

【F I】

C 07 K	5/02	Z N A
C 07 K	5/117	
C 07 K	7/02	
C 07 K	7/06	
C 12 P	21/02	B
A 61 K	37/02	
A 61 K	45/00	
A 61 P	1/04	
A 61 P	7/02	
A 61 P	9/00	
A 61 P	9/10	1 0 1
A 61 P	11/00	
A 61 P	25/00	
A 61 P	25/28	
A 61 P	19/02	
A 61 P	29/00	
A 61 P	29/00	1 0 1
A 61 P	35/04	
A 61 P	37/02	

【手続補正書】

【提出日】平成18年7月3日(2006.7.3)

## 【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】

 $X(A_x)_m A_3 A_1 A_2 A_1 Y$ (式中、 $A_1$ は、D-もしくはL-システイン(C)、又はD-もしくはL-バリン(V)であり； $A_2$ は、D-又はL-アスパラギン酸(D)であり； $A_3$ は、D-もしくはL-フェニルアラニン(F)、又はD-もしくはL-トリプトファン(W)であり； $A_x$ は、グルタミン酸(E)、アスパラギン酸(D)、グリシン(G)およびシステイン(C)からなる群から選ばれたD-又はL-アミノ酸であり；

Xは、前記配列のN-末端側鎖を表して、水素または1~6個のD-もしくはL-アミノ酸またはそれらのアナログを含む残基であり；

Yは、前記配列のC-末端側鎖を表して、-OH、または1~11個のD-もしくはL-アミノ酸またはそれらのアナログを含む残基であり；

XとYは、一緒になって環状系を形成し得る)

によって示されるペプチドの誘導体であって、

XとYの少なくとも1つまたはX+Yが基R<sup>1</sup>-(Z)<sub>n</sub>-によって置換されていることを特徴とするヒトP-セレクチンに対する親和性を有する化合物：

(式中、Zは、-CO-であり、

R<sup>1</sup>は、a) 少なくとも1個のC-原子が窒素原子によって置換されている(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル基；b) -OH及び-COOHから選ばれる少なくとも1個の基によって置換され得る(C<sub>6</sub>~C<sub>14</sub>)アリール基；

から選ばれ；

mおよびnは、個々に、0および1から選ばれる整数である)。

## 【請求項2】

A<sub>x</sub>がD-もしくはL-グルタミン酸(E)またはD-もしくはL-アスパラギン酸を示し、  
A<sub>1</sub>がD-またはL-バリン(V)を示し、A<sub>3</sub>がD-またはL-トリプトファン(W)を示し、

YがD-またはL-リシンを含む残基であり、

R<sup>1</sup>が、未置換フェニルまたは請求項1において定義したような少なくとも1個の置換基で置換されたフェニルであり、

mが0であり、Zが-CO-であり、ZがD-またはL-グリシンまたはアミノ酪酸スペーサーを介してYに結合されている、請求項1記載の化合物。

## 【請求項3】

nが0であり、R<sup>1</sup>が3,4,5-トリヒドロキシフェニルカルボニルまたは3,5-ジカルボキシフェニルカルボニルである、請求項1又は2記載の化合物。

## 【請求項4】

Xがアミノ酸を含まず、YがD-またはL-リシンを含む、請求項1~3のいずれか1項記載の化合物。

## 【請求項5】

環状または束縛主鎖構造体を含む、請求項1~4のいずれか1項記載の化合物。

## 【請求項6】

請求項1~5のいずれか1項記載の化合物を1種又は2種以上と、製薬上許容し得る担体または賦形剤を1種又は2種以上含む組成物。

**【請求項 7】**

薬物ターゲッティング剤および/または生体利用増強剤をさらに含む、請求項 6 記載の  
製薬組成物。

**【請求項 8】**

医薬または診断薬としての請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

**【請求項 9】**

慢性炎症性疾患、リウマチ様関節炎、炎症性腸疾患、多発性硬化症、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、虚血、腎不全のような再灌流障害、腫瘍転移、細菌性敗血症、播種性血管内凝固症候群、成人呼吸ストレス症候群、卒中、脈管形成、移植片拒絶反応、血栓症または循環性ショックの治療、予防または診断用医薬の製造における、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。