

【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】令和 3 年 1 月 14 日 (2021.1.14)

【公表番号】特表 2019-536784 (P2019-536784A)

【公表日】令和 1 年 12 月 19 日 (2019.12.19)

【年通号数】公開・登録公報 2019-051

【出願番号】特願 2019-528663 (P2019-528663)

【国際特許分類】

C 07 K 7/00 (2006.01)

A 61 K 8/64 (2006.01)

A 61 Q 19/00 (2006.01)

A 61 Q 5/00 (2006.01)

A 61 Q 3/00 (2006.01)

A 61 K 38/08 (2019.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 17/04 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 37/02 (2006.01)

C 07 K 14/705 (2006.01)

【 F I 】

C 07 K 7/00 Z N A

A 61 K 8/64

A 61 Q 19/00

A 61 Q 5/00

A 61 Q 3/00

A 61 K 38/08

A 61 P 17/00

A 61 P 37/08

A 61 P 29/00

A 61 P 17/04

A 61 P 17/06

A 61 P 37/02

C 07 K 14/705

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 11 月 27 日 (2020.11.27)

【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】

皮膚、毛髪、爪および / または粘膜の化粧的な非治療的処置および / またはケアにおける、式 (I) :

$$R_1 - W_m - X_n - A A_1 - A A_2 - A A_3 - A A_4 - A A_5 - A A_6 - (A A_7)_a - (A A_8)_b - Y_p - Z_q - R_2 \quad (I)$$

(式中、

AA_1 は Glu であり、 AA_2 は Glu であり、 AA_3 は Met であり、 AA_4 は Gln であり、 AA_5 は Arg であり、 AA_6 は Arg であり、 AA_7 は、 Ala 、 Ser 、 Gly 、 Thr 、 Pro 、 Glu 、 Lys および Val からなる群から選択され、 AA_8 は、 Asp 、 Glu 、 Asn および Gln からなる群から選択され、 AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の 0、1 つまたは 2 つが置き換えられているが、ただし、

AA_1 が置き換えられている場合、それは、 Asp 、 Gln および Asn により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_2 が置き換えられている場合、それは、 Asp および Gln により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_3 が置き換えられている場合、それは、 Leu および Ile により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_4 が置き換えられている場合、それは、 Glu 、 Asn および Asp により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_5 が置き換えられている場合、それは、 Lys により置き換えられていることを条件とし、

AA_6 が置き換えられている場合、それは、 Lys および His により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

a は 1 であり、 b は 0 または 1 であり、

W 、 X 、 Y および Z は、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m 、 n 、 p および q は、それぞれ独立して、0 または 1 であり、

$m + n + p + q$ は、2 未満またはそれと等しく、

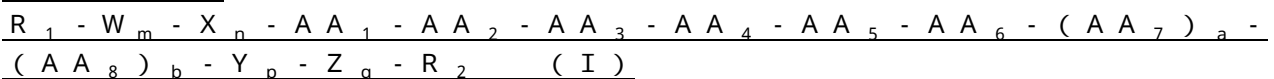
R_1 は、 H 、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、 R_5 は、 H 、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、 R_2 は、 $-NR_3R_4$ 、 $-OR_3$ 、 $-SR_3$ からなる群から選択され、 R_3 および R_4 は、独立して、 H 、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

R_1 および R_2 は、アミノ酸ではない)

の化合物、その立体異性体、および / または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩の使用であって、該化粧的な非治療的処置および / またはケアが、該皮膚の物理的バリア機能および該皮膚の免疫学的バリア機能の維持および / または改善である、使用。

【請求項 2】

皮膚、毛髪、爪および / または粘膜の化粧的な非治療的処置および / またはケアにおける、式 (I) :



(式中、

AA_1 は Glu であり、 AA_2 は Glu であり、 AA_3 は Met であり、 AA_4 は Gln であり、 AA_5 は Arg であり、 AA_6 は Arg であり、 AA_7 は、 Ala 、 Ser 、 Gly 、 Thr 、 Pro 、 Glu 、 Lys および Val からなる群から選択され、

AA_8 は、 Asp 、 Glu 、 Asn および Gln からなる群から選択され、

AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の 0、1 つまたは 2 つが置き換えられているが、ただし、

AA_1 が置き換えられている場合、それは、 Asp 、 Gln および Asn により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_2 が置き換えられている場合、それは、 Asp および Gln により形成される群か

ら選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_3 が置き換えられている場合、それは、Leu および Ile により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_4 が置き換えられている場合、それは、Glu、Asn および Asp により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_5 が置き換えられている場合、それは、Lys により置き換えられていることを条件とし、

AA_6 が置き換えられている場合、それは、Lys および His により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

a は 1 であり、 b は 0 または 1 であり、

W 、 X 、 Y および Z は、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m 、 n 、 p および q は、それぞれ独立して、0 または 1 であり、

$m + n + p + q$ は、2 未満またはそれと等しく、

R_1 は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、 R_5 は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、

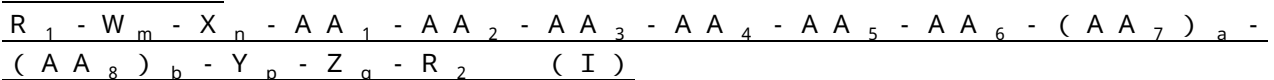
R_2 は、 $-NR_3R_4$ 、 $-OR_3$ 、 $-SR_3$ からなる群から選択され、 R_3 および R_4 は、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

R_1 および R_2 は、アミノ酸ではない)

の化合物、その立体異性体、および / または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩の使用であって、該化粧的な非治療的処置および / またはケアが、該皮膚の物理的バリア機能の維持および / または改善である、使用。

【請求項 3】

皮膚、毛髪、爪および / または粘膜の化粧的な非治療的処置および / またはケアにおける、式 (I) :



(式中、

AA_1 は Glu であり、 AA_2 は Glu であり、 AA_3 は Met であり、 AA_4 は Glu であり、 AA_5 は Arg であり、 AA_6 は Arg であり、 AA_7 は、Ala、Ser、Gly、Thr、Pro、Glu、Lys および Val からなる群から選択され、

AA_8 は、Asp、Glu、Asn および Gln からなる群から選択され、

AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の 0、1 つまたは 2 つが置き換えられているが、ただし、

AA_1 が置き換えられている場合、それは、Asp、Gln および Asn により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_2 が置き換えられている場合、それは、Asp および Gln により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_3 が置き換えられている場合、それは、Leu および Ile により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_4 が置き換えられている場合、それは、Glu、Asn および Asp により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_5 が置き換えられている場合、それは、Lys により置き換えられていることを条件とし、

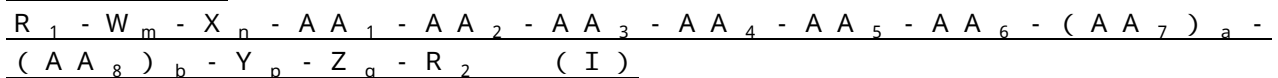
AA_6 が置き換えられている場合、それは、Lys および His により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

a は 1 であり、 b は 0 または 1 であり、

W、X、YおよびZは、それぞれ独立して、アミノ酸であり、
m、n、pおよびqは、それぞれ独立して、0または1であり、
 $m + n + p + q$ は、2未満またはそれと等しく、
 R_1 は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、 R_5 は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、
 R_2 は、 $-NR_3R_4$ 、 $-OR_3$ 、 $-SR_3$ からなる群から選択され、 R_3 および R_4 は、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、
 R_1 および R_2 は、アミノ酸ではない)
 の化合物、その立体異性体、および/または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩の使用であって、該化粧的な非治療的処置および/またはケアが、水および電解質の皮膚からの低下もしくは喪失；皮膚の保湿化の維持および/もしくは改善；皮膚の落屑の予防もしくは低減および/もしくは乾燥皮膚に悩んでいるもしくは乾燥皮膚になる傾向を有する対象における皮膚の落屑の予防もしくは低減である、使用。

【請求項4】

皮膚、毛髪、爪および/または粘膜の化粧的な非治療的処置および/またはケアにおける、式(I)：



(式中、

AA_1 はGluであり、 AA_2 はGluであり、 AA_3 はMetであり、 AA_4 はGlnであり、 AA_5 はArgであり、 AA_6 はArgであり、 AA_7 は、Ala、Ser、Gly、Thr、Pro、Glu、LysおよびValからなる群から選択され、
 AA_8 は、Asp、Glu、AsnおよびGlnからなる群から選択され、
 AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の0、1つまたは2つが置き換えられているが、ただし、

AA_1 が置き換えられている場合、それは、Asp、GlnおよびAsnにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_2 が置き換えられている場合、それは、AspおよびGlnにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_3 が置き換えられている場合、それは、LeuおよびIleにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_4 が置き換えられている場合、それは、Glu、AsnおよびAspにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_5 が置き換えられている場合、それは、Lysにより置き換えられていることを条件とし、

AA_6 が置き換えられている場合、それは、LysおよびHisにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

aは1であり、bは0または1であり、

W、X、YおよびZは、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m、n、pおよびqは、それぞれ独立して、0または1であり、

$m + n + p + q$ は、2未満またはそれと等しく、

R_1 は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、 R_5 は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、
 R_2 は、 $-NR_3R_4$ 、 $-OR_3$ 、 $-SR_3$ からなる群から選択され、 R_3 および R_4 は

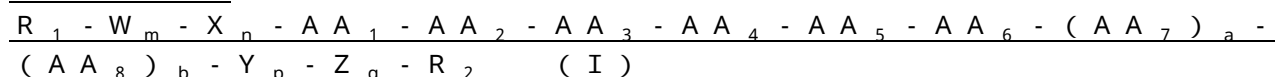
、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

R_1 および R_2 は、アミノ酸ではない)

の化合物、その立体異性体、および/または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩の使用であって、該化粧的な非治療的処置および/またはケアが、皮膚マイクロレリーフの維持および/もしくは改善、および/または皮膚の柔軟さおよび/もしくは皮膚の滑らかな状態の維持および/もしくは改善である、使用。

【請求項5】

皮膚、毛髪、爪および/または粘膜の化粧的な非治療的処置および/またはケアにおける、式(I)：



(式中、

AA_1 はGluであり、 AA_2 はGluであり、 AA_3 はMetであり、 AA_4 はGlnであり、 AA_5 はArgであり、 AA_6 はArgであり、 AA_7 は、Ala、Ser、Gly、Thr、Pro、Glu、LysおよびValからなる群から選択され、

AA_8 は、Asp、Glu、AsnおよびGlnからなる群から選択され、

AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の0、1つまたは2つが置き換えられているが、ただし、

AA_1 が置き換えられている場合、それは、Asp、GlnおよびAsnにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_2 が置き換えられている場合、それは、AspおよびGlnにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_3 が置き換えられている場合、それは、LeuおよびIleにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_4 が置き換えられている場合、それは、Glu、AsnおよびAspにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_5 が置き換えられている場合、それは、Lysにより置き換えられていることを条件とし、

AA_6 が置き換えられている場合、それは、LysおよびHisにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

aは1であり、bは0または1であり、

W、X、YおよびZは、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m、n、pおよびqは、それぞれ独立して、0または1であり、

$m + n + p + q$ は、2未満またはそれと等しく、

R_1 は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、 R_5 は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、

R_2 は、 $-NR_3R_4$ 、 $-OR_3$ 、 $-SR_3$ からなる群から選択され、 R_3 および R_4 は、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

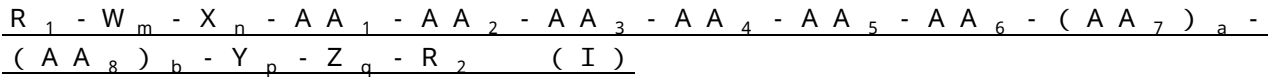
R_1 および R_2 は、アミノ酸ではない)

の化合物、その立体異性体、および/または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩の使用であって、該化粧的な非治療的処置および/またはケアが、化学刺激物、汚濁物質および病原体を含む環境危険物質からの、該皮膚の保護である、使用。

【請求項6】

皮膚、毛髪、爪および/または粘膜の化粧的な非治療的処置および/またはケアにおけ

る、式 (I) :



(式中、

AA_1 は Glu であり、 AA_2 は Glu であり、 AA_3 は Met であり、 AA_4 は Glu であり、 AA_5 は Arg であり、 AA_6 は Arg であり、 AA_7 は、Ala、Ser、Gly、Thr、Pro、Glu、Lys および Val からなる群から選択され、

AA_8 は、Asp、Glu、Asn および Glu からなる群から選択され、

AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の 0、1 つまたは 2 つが置き換えられているが、ただし、

AA_1 が置き換えられている場合、それは、Asp、Glu および Asn により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_2 が置き換えられている場合、それは、Asp および Glu により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_3 が置き換えられている場合、それは、Leu および Ile により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_4 が置き換えられている場合、それは、Glu、Asn および Asp により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_5 が置き換えられている場合、それは、Lys により置き換えられていることを条件とし、

AA_6 が置き換えられている場合、それは、Lys および His により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

a は 1 であり、b は 0 または 1 であり、

W、X、Y および Z は、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m、n、p および q は、それぞれ独立して、0 または 1 であり、

m + n + p + q は、2 未満またはそれと等しく、

R_1 は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、 R_5 は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、

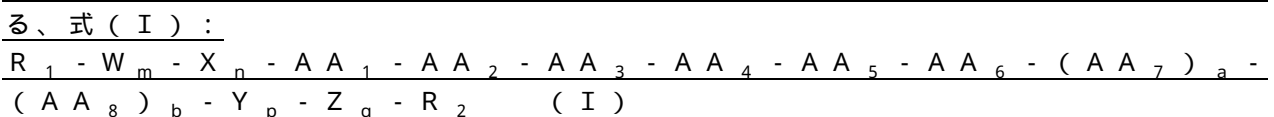
R_2 は、 $-NR_3R_4$ 、 $-OR_3$ 、 $-SR_3$ からなる群から選択され、 R_3 および R_4 は、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

R_1 および R_2 は、アミノ酸ではない)

の化合物、その立体異性体、および / または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩の使用であって、該化粧的な非治療的処置および / またはケアが、該皮膚の自然免疫防御機構の維持および / または改善である、使用。

【請求項 7】

皮膚、毛髪、爪および / または粘膜の化粧的な非治療的処置および / またはケアにおける、式 (I) :



(式中、

AA_1 は Glu であり、 AA_2 は Glu であり、 AA_3 は Met であり、 AA_4 は Glu であり、 AA_5 は Arg であり、 AA_6 は Arg であり、 AA_7 は、Ala、Ser、Gly、Thr、Pro、Glu、Lys および Val からなる群から選択され、

AA_8 は、Asp、Glu、Asn および Glu からなる群から選択され、

AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の 0、1 つまたは 2 つが置き換えられているが、ただし、

AA₁ が置き換えられている場合、それは、Asp、Gln および Asn により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA₂ が置き換えられている場合、それは、Asp および Gln により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA₃ が置き換えられている場合、それは、Leu および Ile により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA₄ が置き換えられている場合、それは、Glu、Asn および Asp により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA₅ が置き換えられている場合、それは、Lys により置き換えられていることを条件とし、

AA₆ が置き換えられている場合、それは、Lys および His により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

a は 1 であり、b は 0 または 1 であり、

W、X、Y および Z は、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m、n、p および q は、それぞれ独立して、0 または 1 であり、

m + n + p + q は、2 未満またはそれと等しく、

R₁ は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび R₅-CO- からなる群から選択され、R₅ は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、

R₂ は、-NR₃R₄、-OR₃、-SR₃ からなる群から選択され、R₃ および R₄ は、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

R₁ および R₂ は、アミノ酸ではない）

の化合物、その立体異性体、および / または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩の使用であって、該化粧的な非治療的処置および / またはケアが、該皮膚の微生物平衡の維持である、使用。

【請求項 8】

対象の皮膚、毛髪、爪および / または粘膜の処置および / またはケアの化粧的な非治療的方法であって、該対象に、化粧的に有効量の式 (I) :

$$R_1 - W_m - X_n - AA_1 - AA_2 - AA_3 - AA_4 - AA_5 - AA_6 - (AA_7)_a - (AA_8)_b - Y_p - Z_q - R_2 \quad (I)$$

(式中、

AA₁ は Glu であり、AA₂ は Glu であり、AA₃ は Met であり、AA₄ は Gln であり、AA₅ は Arg であり、AA₆ は Arg であり、AA₇ は、Ala、Ser、Gly、Thr、Pro、Glu、Lys および Val からなる群から選択され、

AA₈ は、Asp、Glu、Asn および Gln からなる群から選択され、

AA₁、AA₂、AA₃、AA₄、AA₅ および AA₆ の 0、1 つまたは 2 つが置き換えられているが、ただし、

AA₁ が置き換えられている場合、それは、Asp、Gln および Asn により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA₂ が置き換えられている場合、それは、Asp および Gln により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA₃ が置き換えられている場合、それは、Leu および Ile により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA₄ が置き換えられている場合、それは、Glu、Asn および Asp により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA₅ が置き換えられている場合、それは、Lys により置き換えられていることを条件とし、

AA₆が置き換えられている場合、それは、LysおよびHisにより形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

aは1であり、bは0または1であり、

W、X、YおよびZは、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m、n、pおよびqは、それぞれ独立して、0または1であり、

m + n + p + qは、2未満またはそれと等しく、

R₁は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよびR₅-CO-からなる群から選択され、R₅は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、

R₂は、-NR₃R₄、-OR₃、-SR₃からなる群から選択され、R₃およびR₄は、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

R₁およびR₂は、アミノ酸ではない）

の化合物、その立体異性体、および/または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩を投与することを含み、該処置および/またはケアが、該皮膚の物理的バリア機能および該皮膚の免疫学的バリア機能の維持および/もしくは改善；水および電解質の該皮膚からの喪失の低減；該皮膚の潤いの維持および/もしくは改善、すなわち該皮膚の保湿化の維持および/もしくは改善；皮膚マイクロレーフの予防、維持および/もしくは改善；該皮膚の柔軟さおよび/もしくは該皮膚の滑らかな様態の維持および/もしくは改善；化学刺激物、汚濁物質および病原体を含めた環境危険物質からの該皮膚の保護；該皮膚の自然免疫防御機構の維持および/もしくは改善；ならびに/または該皮膚の微生物平衡の維持である、方法。

【請求項9】

AA₁ ~ AA₆の0または1つが置き換えられている、請求項1から7のいずれか一項に記載の使用、または請求項8に記載の方法。

【請求項10】

a = 1およびb = 0であり、好ましくは、(i) AA₁ ~ AA₆の1つが置き換えられている場合、AA₁がAspにより置き換えているか、またはAA₄がAspにより置き換えられており、(ii) AA₁ ~ AA₆の2つが置き換えられている場合、AA₃がAspにより置き換えられており、AA₄がGluにより置き換えられている、請求項1から7または9のいずれか一項に記載の使用、または請求項8または請求項9に記載の方法。

【請求項11】

a = 1およびb = 1であり、好ましくは、(i) AA₁ ~ AA₆の1つが置き換えられている場合、AA₁がAspもしくはGlnにより置き換えられているか、またはAA₃がLeuにより置き換えられているか、またはAA₄がGlu、AspもしくはAsnにより置き換えられているか、またはAA₆がLysもしくはHisにより置き換えられている、請求項1から7または9のいずれか一項に記載の使用、または請求項8または請求項9に記載の方法。

【請求項12】

前記化合物が、R₁-Glu-Glu-Met-Gln-Arg-Arg-Ala-R₂である、請求項1から7のいずれか一項に記載の使用、または請求項8に記載の方法。

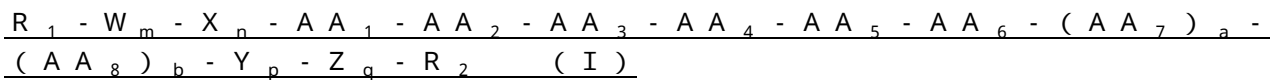
【請求項13】

R₁が、HおよびR₅-CO-からなる群から選択され、R₅が、C₁ ~ C₁₈アルキル、C₂ ~ C₂₄アルケニル、C₃ ~ C₂₄シクロアルキルからなる群から選択され、R₂が、-NR₃R₄または-OR₃であり、R₃およびR₄が、HおよびC₁ ~ C₁₆アルキルからなる群から独立して選択される、請求項1から7もしくは9から12のいずれか一項に記載の使用、または請求項8、請求項9、請求項10、請求項11もしくは請求

項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 4】

アトピー性皮膚炎、接触性皮膚炎、湿疹、乾癬および／または尋常性座瘡の予防または処置における使用などの、皮膚の物理的および／または免疫学的バリア機能の損傷に関連する疾患または障害の処置に使用するための、式 (I) :



(式中、

AA_1 は Glu であり、 AA_2 は Glu であり、 AA_3 は Met であり、 AA_4 は Gln であり、 AA_5 は Arg であり、 AA_6 は Arg であり、 AA_7 は、Ala、Ser、Gly、Thr、Pro、Glu、Lys および Val からなる群から選択され、

AA_8 は、Asp、Glu、Asn および Gln からなる群から選択され、

AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の 0、1 つまたは 2 つが置き換えられているが、ただし、

AA_1 が置き換えられている場合、それは、Asp、Gln および Asn により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_2 が置き換えられている場合、それは、Asp および Gln により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_3 が置き換えられている場合、それは、Leu および Ile により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_4 が置き換えられている場合、それは、Glu、Asn および Asp により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_5 が置き換えられている場合、それは、Lys により置き換えられていることを条件とし、

AA_6 が置き換えられている場合、それは、Lys および His により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

a は 1 であり、b は 0 または 1 であり、

W、X、Y および Z は、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m、n、p および q は、それぞれ独立して、0 または 1 であり、

$m + n + p + q$ は、2 未満またはそれと等しく、

R_1 は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、 R_5 は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、

R_2 は、 $-NR_3R_4$ 、 $-OR_3$ 、 $-SR_3$ からなる群から選択され、 R_3 および R_4 は、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

R_1 および R_2 は、アミノ酸ではない) の化合物、その立体異性体、および／または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩を含む組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 2 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 7】

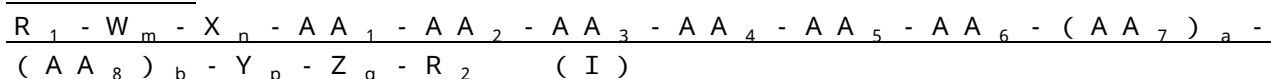
一態様では、本発明は、疾患または障害の処置の方法であって、対象に、式 (I) の化合物、その立体異性体および／もしくはその薬学的に許容される塩、またはそれらを含む

医薬組成物を投与するステップを含む方法を提供する。疾患または障害は、皮膚のバリア機能の損傷に関連する皮膚、毛髪、爪および/または粘膜の疾患または障害を含む。

特定の実施形態では、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

式(I) :



(式中、

AA_1 は Glu であり、 AA_2 は Glu であり、 AA_3 は Met であり、 AA_4 は Gln であり、 AA_5 は Arg であり、 AA_6 は Arg であり、 AA_7 は、Ala、Ser、Gly、Thr、Pro、Glu、Lys および Val からなる群から選択され、

AA_8 は、Asp、Glu、Asn および Gln からなる群から選択され、

AA_1 、 AA_2 、 AA_3 、 AA_4 、 AA_5 および AA_6 の 0、1 つまたは 2 つが置き換えられているが、ただし、

AA_1 が置き換えられている場合、それは、Asp、Gln および Asn により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_2 が置き換えられている場合、それは、Asp および Gln により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_3 が置き換えられている場合、それは、Leu および Ile により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_4 が置き換えられている場合、それは、Glu、Asn および Asp により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

AA_5 が置き換えられている場合、それは、Lys により置き換えられていることを条件とし、

AA_6 が置き換えられている場合、それは、Lys および His により形成される群から選択されるアミノ酸により置き換えられていることを条件とし、

a および b は、それぞれ独立して、0 または 1 であるが、ただし、a が 0 である場合、b は 0 であり、a が 1 である場合、b は 0 または 1 とすることができることを条件とし、

W、X、Y および Z は、それぞれ独立して、アミノ酸であり、

m、n、p および q は、それぞれ独立して、0 または 1 であり、

$m + n + p + q$ は、2 未満またはそれと等しく、

R_1 は、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリール、アラルキルおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、

R_5 は、H、非環式脂肪族基、アリシクリル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され、 R_2 は、 $-NR_3R_4$ 、 $-OR_3$ 、 $-SR_3$ からなる群から選択され、

R_3 および R_4 は、独立して、H、ポリエチレングリコールから誘導されるポリマー、非環式脂肪族基、アリシクリル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールアルキル、アリールおよびアラルキルからなる群から選択され、

R_1 および R_2 は、アミノ酸ではない)

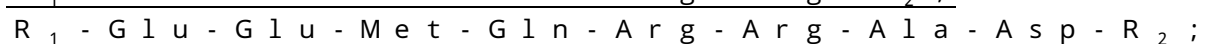
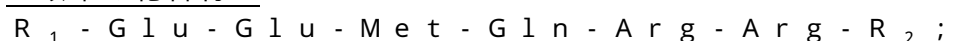
の化合物、その立体異性体、および/または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩。

(項目2)

Ac - Glu - Glu - Met - Gln - Arg - Arg - NH_2 ではない、項目1に記載の化合物。

(項目3)

以下の化合物 :



$R_1 - \text{Glu} - \text{Leu} - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - \text{Ala} - \text{Asp} - R_2$;

$R_1 - \text{Glu} - \text{Leu} - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - \text{Ala} - R_2$;

$R_1 - \text{Glu} - \text{Leu} - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - R_2$;

$R_1 - \text{Leu} - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - \text{Ala} - \text{Asp} - \text{Gln} - R_2$;

$R_1 - \text{Leu} - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - \text{Ala} - \text{Asp} - R_2$;

$R_1 - \text{Leu} - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - \text{Ala} - R_2$;

$R_1 - \text{Leu} - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - R_2$;

$R_1 - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - \text{Ala} - \text{Asp} - \text{Gln} - \text{Leu} - R_2$;

$R_1 - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - \text{Ala} - \text{Asp} - \text{Gln} - R_2$; および

$R_1 - \text{Glu} - \text{Glu} - \text{Met} - \text{Gln} - \text{Arg} - \text{Arg} - \text{Ala} - R_2$

の1つではない、項目1に記載の化合物。

(項目4)

$AA_1 \sim AA_6$ の0または1つが置き換えられている、項目1に記載の化合物。

(項目5)

$a = b = 0$ であり、好ましくは、(i) $AA_1 \sim AA_6$ の1つが置き換えられている場合、 AA_1 が Asp もしくは Gln により置き換えられているか、または AA_2 が Asp もしくは Gln により置き換えられているか、または AA_3 が Leu により置き換えられているか、または AA_4 が Glu もしくは Asn により置き換えられているか、または AA_5 が Lys により置き換えられているか、または AA_6 が Lys により置き換えられており、(ii) $AA_1 \sim AA_6$ の2つが置き換えられている場合、 AA_3 が Ile により置き換えられており、 AA_4 が Glu により置き換えられているか、または AA_5 が Lys により置き換えられており、 AA_6 が Lys により置き換えられている、前記項目のいずれか一項に記載の化合物。

(項目6)

$a = 1$ および $b = 0$ であり、好ましくは、(i) $AA_1 \sim AA_6$ の1つが置き換えられている場合、 AA_1 が Asp により置き換えられているか、または AA_4 が Asp により置き換えられており、(ii) $AA_1 \sim AA_6$ の2つが置き換えられている場合、 AA_3 が Asp により置き換えられており、 AA_4 が Glu により置き換えられている、項目1から3のいずれか一項に記載の化合物。

(項目7)

$a = 1$ および $b = 1$ であり、好ましくは、(i) $AA_1 \sim AA_6$ の1つが置き換えられている場合、 AA_1 が Asp もしくは Gln により置き換えられているか、または AA_3 が Leu により置き換えられているか、または AA_4 が Glu 、 Asp もしくは Asn により置き換えられているか、または AA_6 が Lys もしくは His により置き換えられている、項目1から3のいずれか一項に記載の化合物。

(項目8)

R_1 が、Hおよび $R_5 - CO -$ からなる群から選択され、 R_5 が、 $C_1 \sim C_{18}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{24}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{24}$ シクロアルキルからなる群から選択され、 R_2 が、 $-NR_3R_4$ または $-OR_3$ であり、 R_3 および R_4 が、Hおよび $C_1 \sim C_{16}$ アルキルからなる群から独立して選択される、項目1から6のいずれか一項に記載の化合物。

。

(項目9)

(i) 項目2、または項目2に従属する項目3から8のいずれか一項に記載の化合物、および(ii) $Ac - Glu - Glu - Met - Gln - Arg - Arg - NH_2$ を含む

、化粧用組成物または医薬組成物。

(項目 10)

皮膚、毛髪、爪および／または粘膜の化粧的な非治療的処置および／またはケアにおける、項目 1 から 8 のいずれか一項に記載の化合物または項目 9 に記載の化粧用組成物の化粧的な非治療的使用。

(項目 11)

前記化粧的な非治療的処置および／またはケアが、皮膚の物理的バリア機能および皮膚の免疫学的バリア機能の維持および／または改善である、項目 10 に記載の化粧的な非治療的使用。

(項目 12)

前記化粧的な非治療的処置および／またはケアが、水および電解質の皮膚からの低下もしくは喪失；皮膚の保湿化の維持および／もしくは改善；皮膚の落屑の予防もしくは低減；乾燥皮膚に悩んでいるもしくは乾燥皮膚になる傾向を有する対象における皮膚の落屑の予防もしくは低減；皮膚マイクロレリーフの維持および／もしくは改善；皮膚の柔軟さおよび／もしくは皮膚の滑らかな様態の維持および／もしくは改善；皮膚健康の維持および／もしくは改善；化学刺激物、汚濁物質および病原体を含めた環境危険物質からの皮膚の保護；皮膚の自然免疫防御機構の維持および／もしくは改善；ならびに／または皮膚の微生物平衡の維持である、項目 10 に記載の化粧的な非治療的使用。

(項目 13)

医薬として使用するための、式 (I) の化合物、その立体異性体および／もしくはその薬学的に許容される塩、または項目 9 に記載の医薬組成物。

(項目 14)

アトピー性皮膚炎、接触性皮膚炎、湿疹、乾癬および／または尋常性座瘡の予防または処置における使用などの、皮膚の物理的および／または免疫学的バリア機能の損傷に関連する疾患または障害の処置に使用するための、式 (I) の化合物、その立体異性体および／もしくはその薬学的に許容される塩、または項目 9 に記載の医薬組成物。

(項目 15)

項目 1 から 8 のいずれか一項に記載の、式 (I) の化合物、その立体異性体および／または化粧品としてもしくは薬学的に許容されるその塩を、化粧品として有効なまたは薬学的に有効な量で、ならびに少なくとも 1 つの化粧品として許容される賦形剤またはアジュバントを含む、化粧用組成物または医薬組成物。

(項目 16)

化粧品として有効量の項目 1 から 8 のいずれか一項に記載の化合物、その立体異性体および／または化粧品として許容されるその塩、あるいは化粧品として有効量の該化合物、その立体異性体および／または化粧品として許容されるその塩を含む化粧品用組成物を、対象に投与するステップを含む、該対象の皮膚、毛髪、爪および／または粘膜を処置および／またはケアする化粧的な非治療的方法であって、該処置および／またはケアが、皮膚の物理的バリア機能および皮膚の免疫学的バリア機能の維持および／もしくは改善；水および電解質の皮膚からの喪失の低減；皮膚の潤いの維持および／もしくは改善、すなわち皮膚の保湿化の維持および／もしくは改善；皮膚マイクロレリーフの予防、維持および／もしくは改善；皮膚の柔軟さおよび／もしくは皮膚の滑らかな様態の維持および／もしくは改善；皮膚健康の維持および／もしくは改善；化学刺激物、汚濁物質および病原体を含めた環境危険物質からの皮膚の保護；皮膚の自然免疫防御機構の維持および／もしくは改善；ならびに／または皮膚の微生物平衡の維持である、化粧的な非治療的方法。

(項目 17)

前記化粧用組成物が項目 9 に記載の化粧用組成物である、項目 16 に記載の化粧的な非治療的方法。