

【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 6 年 10 月 28 日(2024.10.28)

【公開番号】特開 2024-88768(P2024-88768A)
【公開日】令和 6 年 7 月 2 日(2024.7.2)
【年通号数】公開公報(特許)2024-122
【出願番号】特願 2024-63204(P2024-63204)
【国際特許分類】

C 0 7 K 5/062(2006.01)	10
A 6 1 P 35/00(2006.01)	
A 6 1 P 43/00(2006.01)	
A 6 1 K 45/00(2006.01)	
A 6 1 K 31/7068(2006.01)	
A 6 1 K 38/05(2006.01)	
A 6 1 K 31/085(2006.01)	
C 0 7 K 5/08(2006.01)	
C 0 7 K 5/06(2006.01)	
C 1 2 N 9/99(2006.01)	
C 0 7 K 16/30(2006.01)	20

【F I】

C 0 7 K 5/062	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 43/00 1 2 1	
A 6 1 K 45/00	
A 6 1 K 31/7068	
A 6 1 K 38/05	
A 6 1 K 31/085	
C 0 7 K 5/08	
C 0 7 K 5/06	30
C 1 2 N 9/99	
C 0 7 K 16/30	

【手続補正書】
【提出日】令和 6 年 10 月 17 日(2024.10.17)

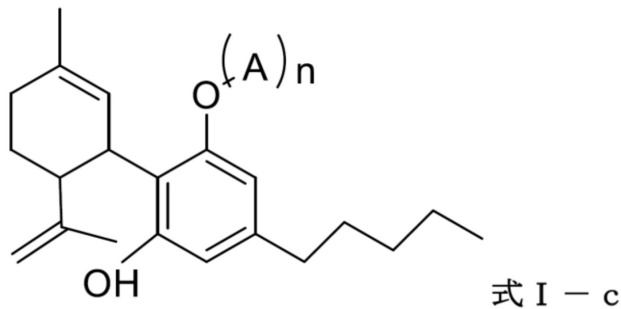
【手続補正 1】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

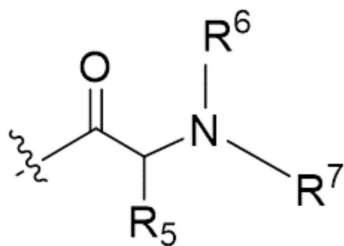
式 I - c :

【化 1】



10

により表される化合物であって、式中、
 A は、アミノ酸残基であり、各 A は、独立して、
 【化 2】



20

により表され、ここで、
 R⁵ は、H であるか、あるいは OH、SH、SC₁₋₄ アルキル、ヘテロアリール、CONH₂、COOH、NH₂、NHC(NH)NH₂、イミダゾリル、またはアリール (C₁₋₄ アルキルまたは OH で置換されていてもよい) で置換されていてもよい、C₁₋₁₀ アルキルであり、
 R⁶ および R⁷ は、各例において、それぞれ独立して、H であるか、あるいは OH、SH、SC₁₋₄ アルキル、ヘテロアリール、CONH₂、COOH、NH₂、またはアリールで置換されていてもよい、C₁₋₁₀ アルキルであり、ただし R⁷ は、前記アミノ酸残基が非末端の位置にある場合、カルボニル基に対する共有結合であり、
 n は、1 ~ 9 の範囲の整数であり、
 R⁵ と R⁶ が結合して 5 ~ 7 員環を形成してもよい、
 化合物。

30

【請求項 2】

n が、1、2 または 3 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

各 A が、独立して、リジン、ロイシン、イソロイシン、グリシン、アスパラギン酸、グルタミン酸、メチオニン、アラニン、バリン、プロリン、ヒスチジン、チロシン、セリン、アルギニン、フェニルアラニン、およびトリプトファンから選択される、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

40

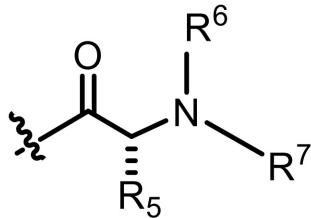
【請求項 4】

n が 2 であり、各 A が、独立して、リジン、ロイシン、イソロイシン、グリシン、アスパラギン酸、グルタミン酸、メチオニン、およびアラニンから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

A のうちの少なくとも 1 つが、

【化 3】



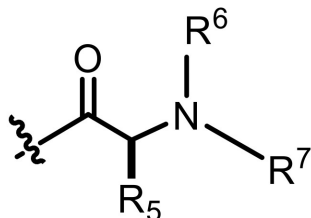
である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

10

【請求項 6】

A のうちの少なくとも 1 つが、

【化 4】



20

である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

治療上有効量の請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物と、代謝拮抗薬、免疫チェックポイント阻害剤、有糸分裂阻害剤、アルキル化剤、白金ベースの抗悪性腫瘍薬、抗体ベースの E G F R 阻害剤、抗体ベースの H E R 2 / 3 阻害剤、血管新生阻害剤、m T O R 阻害剤、C D K 4 阻害剤、C D K 6 阻害剤、およびアロマターゼ阻害剤からなる群から選択される二次的な作用物質と、を含むキット。

30

【請求項 9】

前記二次的な作用物質が、ゲムシタピンである、請求項 8 に記載のキット。

【請求項 10】

G P R 5 5 を阻害する方法であって、G P R 5 5 を治療上有効量の請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物と接触させるステップを含む、方法。

【請求項 11】

G P R 5 5 が、E R K リン酸化の増大に関連している、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 12】

G P R 5 5 が、対象の腫瘍細胞で過剰発現している、請求項 10 または 11 に記載の方法。

40

【請求項 13】

P E P T 1 を調節する方法であって、P E P T 1 を治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物と接触させるステップを含む、方法。

【請求項 14】

対象において疾患を処置する方法であって、前記対象に治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物を投与するステップを含み、

前記疾患は、がん、肥満、真性糖尿病、炎症性および神経障害性疼痛、脈管構造、がん、炎症、胃腸管疾患、および骨疾患からなる群から選択される、方法。

【請求項 15】

50

前記がんが、肺がん、胃がん、膵がん、扁平上皮がん、卵巣がん、前立腺がん、結腸直腸がん、卵巣がん、胆管細胞癌、神経膠芽腫、およびトリプルネガティブ乳がんからなる群から選択される、請求項 14 に記載の方法。

10

20

30

40

50