

【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 21 年 8 月 20 日 (2009.8.20)

【公開番号】特開 2005-255556 (P2005-255556A)

【公開日】平成 17 年 9 月 22 日 (2005.9.22)

【年通号数】公開・登録公報 2005-037

【出願番号】特願 2004-66256 (P2004-66256)

【国際特許分類】

C 0 7 K 1/12 (2006.01)

C 0 7 K 5/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 1/12

C 0 7 K 5/08

【手続補正書】

【提出日】平成 21 年 7 月 7 日 (2009.7.7)

【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】

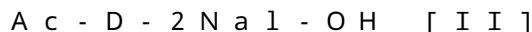
【請求項 1】

工程 ( 1 ) ~ ( 4 ) の少なくとも 1 つを包含する式 [ I ] :



で表されるトリペプチドまたはその塩の製造方法 :

( 1 ) 式 [ I I ] :



で表される化合物、その塩、またはその反応性誘導体と、式 [ I I I ] :



( 式中、 $R ^ 1$  は、メチル、エチルまたはベンジルを示す。 )

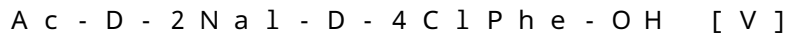
で表される化合物またはその塩とを縮合させることによって、式 [ I V ] :



( 式中、 $R ^ 1$  は上記定義の通りである。 )

で表される化合物を調製する工程 ;

( 2 ) 上記式 [ I V ] で表される化合物を加水分解反応に付し、式 [ V ] :



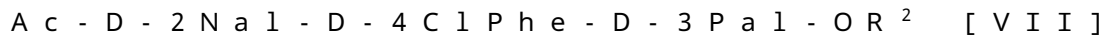
で表される化合物またはその塩を調製する工程 ;

( 3 ) 上記式 [ V ] で表される化合物、その塩、またはその反応性誘導体と、式 [ V I ] :



( 式中、 $R ^ 2$  は、メチル、エチルまたはベンジルを示す。 )

で表される化合物またはその塩とを縮合させることによって、式 [ V I I ] :



( 式中、 $R ^ 2$  は上記定義の通りである。 )

で表される化合物またはその塩を調製する工程 ; および

( 4 ) 上記式 [ V I I ] で表される化合物またはその塩を加水分解反応に付し、上記式 [ I ] で表されるトリペプチドまたはその塩を得る工程。

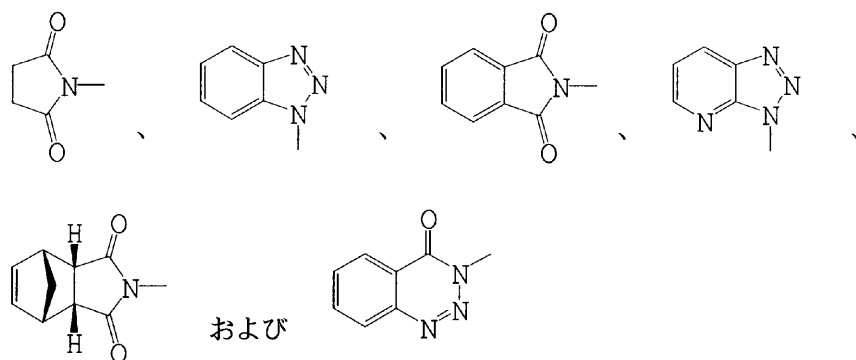
【請求項 2】

式 [ I I ] で表される化合物の反応性誘導体が、式 [ I I a ] :



(式中、 $\text{R}^a$  は、

【化 1】



からなる群から選択される基を示す。)

で表される化合物である、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 3】

$\text{R}^1$  がメチルである、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 4】

式 [ I I I ] で表される化合物の塩が、 $\text{H} - \text{D} - 4\text{ClPhe} - \text{OMe} \quad \text{HCl}$  である、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 5】

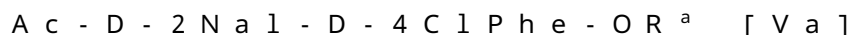
$\text{R}^2$  がメチルである、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 6】

式 [ V I ] で表される化合物の塩が、 $\text{H} - \text{D} - 3\text{Pal} - \text{OMe} \quad 2\text{HCl}$  である、請求項 1 に記載の製造方法。

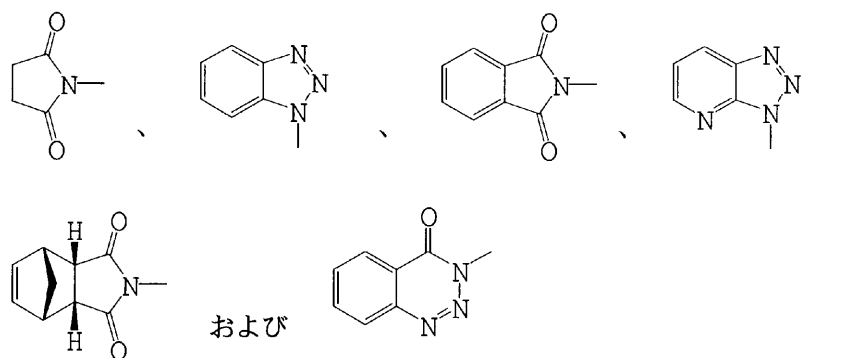
【請求項 7】

式 [ V ] で表される化合物の反応性誘導体が、式 [ V a ] :



(式中、 $\text{R}^a$  は、

【化 2】



からなる群から選択される基を示す。)

で表される化合物である、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 8】

工程 ( 2 ) の加水分解反応において塩基を用いる、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 9】

塩基が水酸化ナトリウムである、請求項 8 に記載の製造方法。

【請求項 10】

工程(2)の加水分解反応において、溶媒として、テトラヒドロフランを用いる、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 11】

工程(4)の加水分解反応において塩基を用いる、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 12】

塩基が水酸化ナトリウムである、請求項 11 に記載の製造方法。

【請求項 13】

工程(4)の加水分解反応において、溶媒として、テトラヒドロフランと水との混合溶媒を用いる、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の製造方法によって、式 [ I ] :



で表されるトリペプチドまたはその塩を製造する工程、および前記トリペプチドまたはその塩を LHRH アнтаゴニストに変換する工程を含む、LHRH アнтаゴニストの製造方法。