

【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 07 K 1/12 (2006.01)

C 07 K 5/08 (2006.01)

【F I】

C 07 K 1/12

C 07 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]：

A c - D - 2 N a l - D - 4 C 1 P h e - D - 3 P a l - O H [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[II]：

A c - D - 2 N a l - O H [II]

で表される化合物、その塩、またはその反応性誘導体と、式[III]：

H - D - 4 C 1 P h e - O R¹ [III]

(式中、R¹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[IV]：

A c - D - 2 N a l - D - 4 C 1 P h e - O R¹ [IV]

(式中、R¹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[IV]で表される化合物を加水分解反応に付し、式[V]：

A c - D - 2 N a l - D - 4 C 1 P h e - O H [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[VI]：

H - D - 3 P a l - O R² [VI]

(式中、R²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[VII]：

A c - D - 2 N a l - D - 4 C 1 P h e - D - 3 P a l - O R² [VII]

(式中、R²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[VII]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。

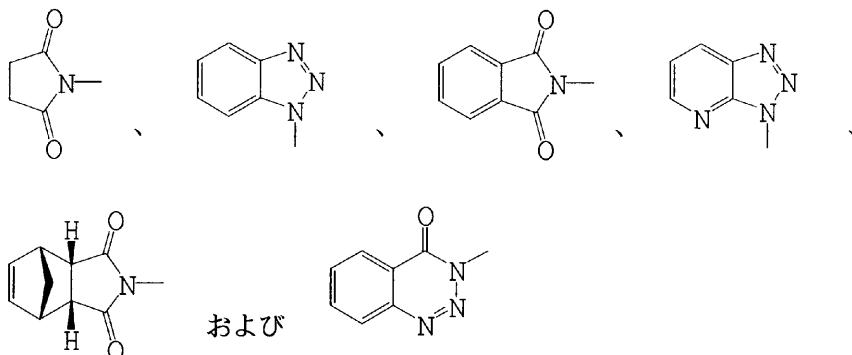
【請求項2】

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、 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】

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、H - D - 4 C l P h e - O M e H C l である
、請求項 1 に記載の製造方法。

【請求項 5】

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、H - D - 3 P a l - O M e 2 H C l である、請
求項 1 に記載の製造方法。

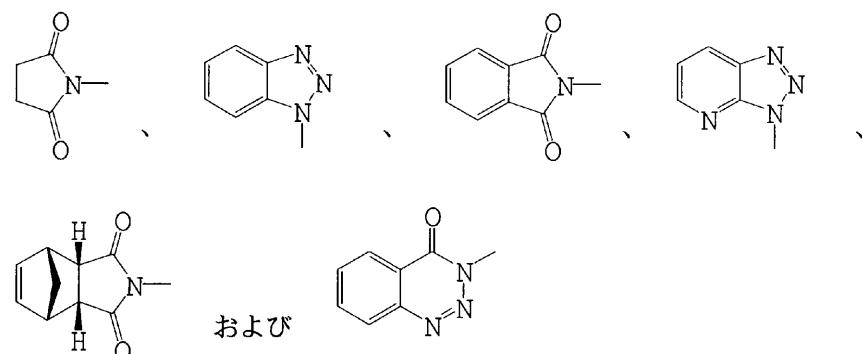
【請求項 7】

式 [V] で表される化合物の反応性誘導体が、式 [V a] :



(式中、 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】

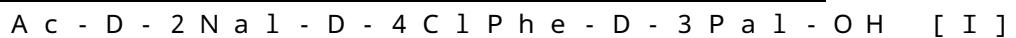
塩基が水酸化ナトリウムである、請求項 11 に記載の製造方法。

【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 アンタゴニストに変換する工程を含む、LHRH アンタゴニストの製造方法。