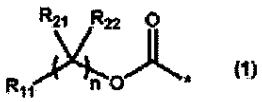
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和6年2月26日(2024.2.26)

【国際公開番号】WO2022/196797
【出願番号】特願2023-507198(P2023-507198)
【国際特許分類】
C07K 1/06(2006.01)
C07K 1/02(2006.01)
C07D233/60(2006.01)
【ＦＩ】
C07K 1/06
C07K 1/02
C07D233/60 １０４

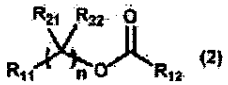
【手続補正書】
【提出日】令和4年9月29日(2022.9.29)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
側鎖アミノ基が下記式（１）で示される第一保護基で保護された第一アミノ酸又はペプチドと、第二アミノ酸又はペプチドとを反応させて、第三アミノ酸又はペプチドを得るペプチド鎖伸長工程、
第三アミノ酸又はペプチドの第一保護基を脱保護する、第一脱保護工程、を含み、
第一脱保護工程は、トリフルオロ酢酸含有量１０質量％以下の脱保護溶液を用いて脱保護する、
ペプチドの製造方法。
【化１】



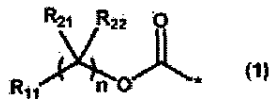
(1)

式中、R_{11}は置換基を有するアリール基であり、R_{21}及びR_{22}はそれぞれ独立に水素原子又は置換基であり、ｎは１～６の整数であり、星印は連結部を示す。
【請求項２】
脱保護溶液のトリフルオロ酢酸含有量が２質量％以下である、請求項１に記載のペプチドの製造方法。
【請求項３】
Ｃ末端保護剤によりＮ末端保護アミノ酸又はペプチドのカルボキシ基又はアミド基を保護するＣ末端保護工程、
前記Ｃ末端保護工程で得られたＮ末端Ｃ末端保護アミノ酸又はペプチドのＮ末端保護基を脱保護するＮ末端脱保護工程、
前記Ｎ末端脱保護工程で得られたＣ末端保護アミノ酸又はペプチドのＮ末端に、Ｎ末端保護アミノ酸又はペプチドを縮合させるペプチド鎖伸長工程、及び、
Ｃ末端保護基を、脱保護するＣ末端脱保護工程、をさらに含み、
Ｃ末端保護アミノ酸又はペプチド、及び、Ｎ末端保護アミノ酸又はペプチドのいずれか

は、前記第一保護基で保護された第一アミノ酸又はペプチドである、
請求項１又は２に記載のペプチドの製造方法。
【請求項４】
　Ｒ１１のアリール基の置換基は電子供与性基であり、複数あるときは同一でも異なってもよい、請求項１～３のいずれか一項に記載のペプチドの製造方法。
【請求項５】
　前記電子供与性基は、アミノ基、アルコキシアルキル基、アルコキシ基、又はアルキル基であり、これらはさらに置換基を有してもよい、請求項１～４のいずれか一項に記載のペプチドの製造方法。
【請求項６】
　前記電子供与性基は、炭素数１～１０のアルコキシ基である、請求項１～４のいずれか一項に記載のペプチドの製造方法。
【請求項７】
　前記アリール基がフェニル基又はナフチル基である、請求項１～６のいずれか一項に記載のペプチドの製造方法。
【請求項８】
　前記第一保護基は、アルギニンのグアニジノ基の保護基である、請求項１～７のいずれか一項に記載のペプチドの製造方法。
【請求項９】
　第一アミノ酸又はペプチドと、下記式（２）で示される保護基形成用試薬とを反応させて側鎖アミノ基が第一保護基で保護された第一保護アミノ酸又はペプチドを得る、保護工程、
を含むアミノ酸又はペプチドの製造方法。
【化２】

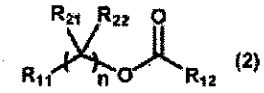


式中、Ｒ１１は置換基を有するアリール基であり、Ｒ１２は、置換基を有してもよいアリール基、置換基を有してもよいヘテロ脂肪族環基、又は置換基を有してもよいヘテロアリール基であり、それらは酸素原子又は硫黄原子を介して連結されていてもよく、Ｒ２１及びＲ２２はそれぞれ独立に水素原子又は置換基であり、ｎは１～６の整数である。
【請求項１０】
　下記式（１）で示される保護基を有する、アルギニン又はアルギニン残基を含有する化合物。
【化３】



式中、Ｒ１１は電子供与性基を有するアリール基であり、電子供与性基が複数あるときはそれらは同一でも異なってもよく、Ｒ２１及びＲ２２はそれぞれ独立に水素原子又は置換基であり、ｎは１～６の整数であり、星印は連結部を示す。
【請求項１１】
　前記電子供与性基は、アミノ基、アルコキシアルキル基、アルコキシ基又はアルキル基であり、これらは置換基を有してもよい、請求項１０に記載のアルギニン又はアルギニン残基を含有する化合物。
【請求項１２】
　電子供与性基は、炭素数１～１０のアルコキシ基である、請求項１１に記載のアルギニン又はアルギニン残基を含有する化合物。

【請求項１３】
アリール基がフェニル基又はナフチル基である、請求項１０～１２のいずれか一項に記載のアルギニン又はアルギニン残基を含有する化合物。
【請求項１４】
保護基は、アルギニンのグアニジノ基の保護基である、請求項１０～１３のいずれか一項に記載のアルギニン又はアルギニン残基を含有する化合物。
【請求項１５】
さらに９－フルオレニルメトキシカルボニル基を有する、請求項１０～１４のいずれか一項に記載のアルギニン又はアルギニン残基を含有する化合物。
【請求項１６】
下記式（２）で示される、アミノ酸又はペプチドの側鎖アミノ基の保護基形成用試薬。
【化４】



式中、Ｒ１１は置換基を有してもよいアリール基であり、Ｒ１２は、置換基を有してもよいアリール基、置換基を有してもよいヘテロ脂肪族環基、又は置換基を有してもよいヘテロアリール基であり、それらは酸素原子又は硫黄原子を介して連結されていてもよく、Ｒ２１及びＲ２２はそれぞれ独立に水素原子又は置換基であり、ｎは１～６の整数である。