

【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 25 年 1 月 10 日 (2013.1.10)

【公開番号】特開 2012-211164 (P2012-211164A)

【公開日】平成 24 年 11 月 1 日 (2012.11.1)

【年通号数】公開・登録公報 2012-045

【出願番号】特願 2012-138485 (P2012-138485)

【国際特許分類】

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 7/06 Z N A

A 6 1 K 37/02

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 11 月 16 日 (2012.11.16)

【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

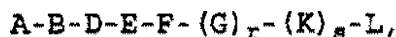
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下式

【化 1】

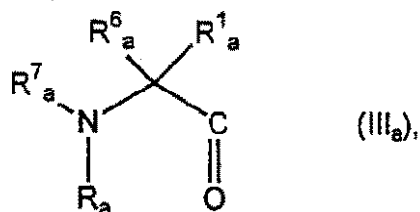


{ 式中、

r 及び s が 0 であり、

A が、式 I I I_a

【化 2】



で示され、

R_a が水素又は非置換 C₁ - C₃ アルキルを意味し、

R¹_a が C₁ - C₄ アルキルを意味し、

R⁶_a が、メチル、ヒドロキシル若しくはメトキシ置換 C₁ - C₃ アルキル、フェニル又はフッ素原子若しくはメトキシ置換フェニルを意味し、

R⁷_a が水素又は C₁ - C₃ アルキルを意味する

B が、バリン、イソロイシン又は 2 - tert - ブチルグリシン残基を意味し、

で示され、

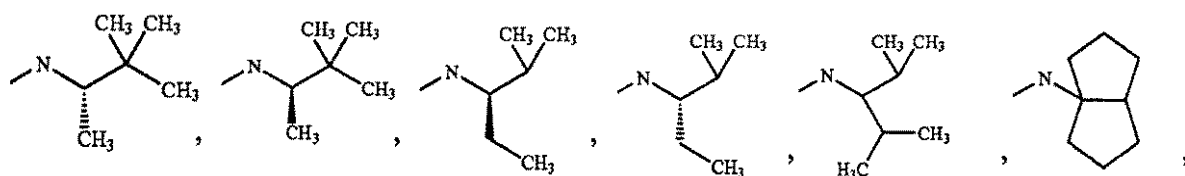
D が、N - メチルバリン残基又は N - メチルイソロイシン残基を意味し、

E が、プロリル、チアゾリジニル - 4 - カルボニル又は 3 , 4 - ジヒドロプロピルを意味し、

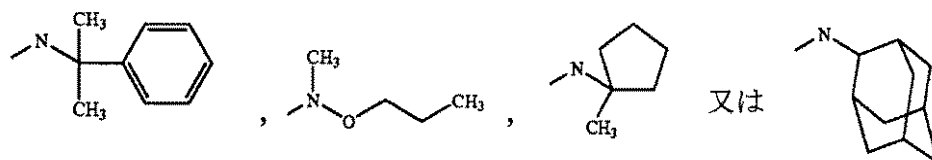
F がプロリルを意味し、

L が、N - ベンジルアミド、N - メトキシ - N - ベンジルアミド、tert - ブチルアミド、tert - ブチルエステル、N - メトキシ - N - メチルアミド、イソプロピルアミド、5 - フェニルイソオキサゾリジニル、イソオキサゾリジニル、ペンチルアミド、(R) 又は (S) フェネチルアミド、- O - tert - ブチル、

【化 3】



【化 4】



を意味する。 }、

で表わされる化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 2】

[2 - N , N - ジメチルアミノ] - イソ酪酸 - Val - MeVal - Pro - Pro - NH ベンジル、

[N , N - ジメチル - 2 - エチル - 2 - フェニルグリシル] - Val - MeVal - Pro - Pro - NH ベンジル x HCl、

X a x	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 1
X a x	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 2
X a z	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 1
X a z	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 2
X b b	V a l	X a a	P r o	X a b	
X b d	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 1
X b d	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 2
X b g	V a l	X a a	P r o	X a b	
X b i	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 1
X b i	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 2
X b k	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 1
X b k	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 2
X b l	V a l	X a a	P r o	X a b	
X b m	V a l	X a a	P r o	X a b	
X b l	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 1
X b l	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 2

X a u	V a l	X a a	P r o	X b p	
X a u	V a l	X a a	P r o	X b x	
X b i	V a l	X a a	P r o	X b x	異性体 2
X a u	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 1
X a u	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 2
X a u	V a l	X a a	P r o	X c b	
X b i	V a l	X a a	P r o	X c b	異性体 1
X b i	V a l	X a a	P r o	X c b	異性体 2
X b i	V a l	X a a	P r o	X c c	異性体 1
X b i	V a l	X a a	P r o	X c c	異性体 2
X b i	V a l	X a a	P r o	X c d	
X b k	V a l	X a a	P r o	X c c	異性体 1
X b k	V a l	X a a	P r o	X c c	異性体 2
X a x	V a l	X a a	P r o	X b p	異性体 1
X a x	V a l	X a a	P r o	X b p	異性体 2
X b k	V a l	X a a	P r o	X c b	異性体 1
X b k	V a l	X a a	P r o	X c b	異性体 2
X a u	V a l	X a a	P r o	X c c	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c d	
X a u	V a l	X a a	P r o	X b p	異性体 1
X a u	V a l	X a a	P r o	X b p	異性体 2
X b k	V a l	X a a	P r o	X c d	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c h	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c i	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c k	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c l	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c m	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c n	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c o	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c p	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c q	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c r	
X a u	V a l	X a a	P r o	X b r	
X a d	V a l	X a a	X a l	X b x	
X a u	V a l	X a a	X a l	X b x	
X a d	V a l	X a a	X a l	X c h	
X a u	V a l	X a a	X a l	X c h	
X a u	V a l	X a a	X a l	X c r	
X a u	V a l	X a a	X a n	X b x	
X a u	V a l	X a a	X a n	X c h	
X a u	V a l	X a a	X a n	X c r	
X a u	I l e	X a a	P r o	X b x	
X a u	I l e	X a a	P r o	X c h	
X a u	X c s	X a a	P r o	X c h	
X a u	X c s	X a a	P r o	X b x	
X a u	V a l	X c t	P r o	X c h	
X a u	V a l	X c t	P r o	X b x	

[但し、上記各略号は以下のアミノ酸又はアミノ酸残基を示す：

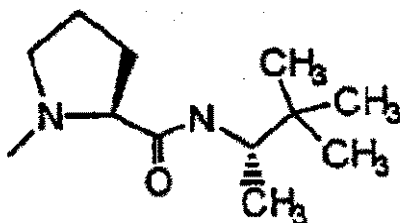
X a a： N - メチルバリン

X a b： プロリル N - ベンジルアミド

X a u : N , N - ジメチル - 2 - エチル - 2 - フェニルグリシン
 X a x : N , N - ジメチル - 2 - [2 - フルオロ] フェニルグリシン
 X a z : N , N - ジメチル - 2 - [4 - フルオロ] フェニルグリシン
 X b b : 2 - (R , S) - エチル - 2 - フェニルグリシン
 X b d : N , N - ジメチル - 2 - (R , S) - 2 - フェニルグリシン
 X b g : N - イソプロピル - 2 - (R , S) - エチル - 2 - フェニルグリシン
 X b i : N , N - ジメチル - 2 - プロピル - 2 - フェニルグリシン
 X b k : N , N - ジメチル - 2 - [4 - メトキシ] フェニルグリシン
 X b l : N - メチル - 3 - ヒドロキシ - D , L - バリン
 X b m : N , N - ジメチル - D , L - 2 - イソプロピル - 2 - フェニルグリシン
 X b p : プロリン - イソプロピルアミド
 X b r : プロリン - N - メトキシ - N - ベンジルアミド
 X b x : プロリン - t e r t - ブチルアミド
 X c b : プロリンペンチル (3) アミド
 X c c : プロリン - (R) - フェネチルアミド
 X c d : プロリン - (S) - フェネチルアミド

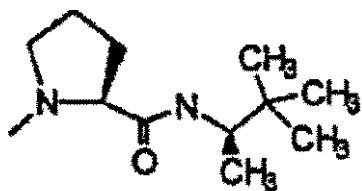
【化 5】

Xch:

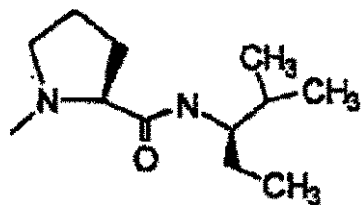


【化 6】

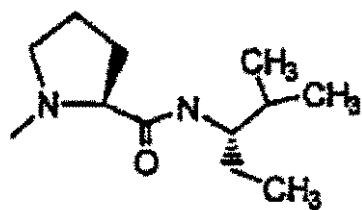
Xci:



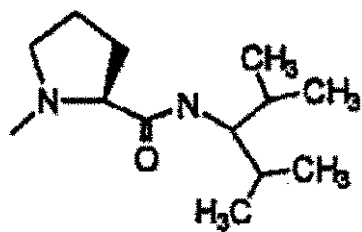
Xck:



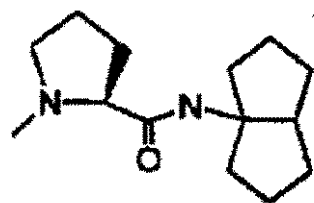
Xcl:



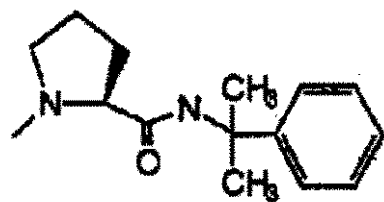
Xcm:



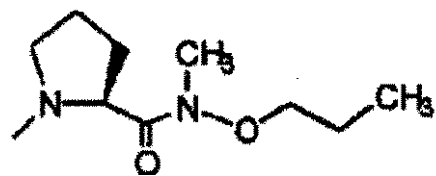
Xcn:



Xco:

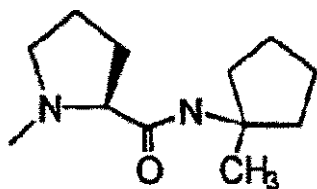


Xcp:

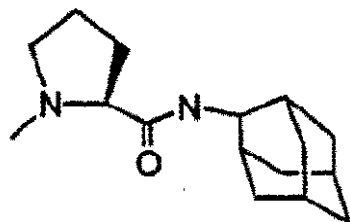


【化 7】

Xcq:



Xcr:



Xct: N - メチル - L - イソロイシン。]

から選択される化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 3】

[2 - N , N - ジメチルアミノ] - イソ酪酸 - Val - MeVal - Pro - Pro - NHベンジル、

[N , N - ジメチル - 2 - エチル - 2 - フェニルグリシル] - Val - MeVal - Pro - Pro - NHベンジル × HCl

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 4】

Xax Val Xaa Pro Xab 異性体 1

Xax Val Xaa Pro Xab 異性体 2

Xaz Val Xaa Pro Xab 異性体 1

Xaz Val Xaa Pro Xab 異性体 2

Xbb Val Xaa Pro Xab

Xbd Val Xaa Pro Xab 異性体 1

Xbd Val Xaa Pro Xab 異性体 2

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 5】

Xbg Val Xaa Pro Xab

Xbi Val Xaa Pro Xab 異性体 1

Xbi Val Xaa Pro Xab 異性体 2

Xbk Val Xaa Pro Xab 異性体 1

Xbk Val Xaa Pro Xab 異性体 2

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 6】

Xbl Val Xaa Pro Xab

Xbm Val Xaa Pro Xab

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 7】

Xbl Val Xaa Pro Xab 異性体 1

Xbl Val Xaa Pro Xab 異性体 2

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 8】

Xau Val Xaa Pro Xbp

Xau Val Xaa Pro Xbx

Xbi Val Xaa Pro Xbx 異性体 2

X a u	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 1
X a u	V a l	X a a	P r o	X a b	異性体 2
X a u	V a l	X a a	P r o	X c b	
X b i	V a l	X a a	P r o	X c b	異性体 1
X b i	V a l	X a a	P r o	X c b	異性体 2
X b i	V a l	X a a	P r o	X c c	異性体 1
X b i	V a l	X a a	P r o	X c c	異性体 2

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 9】

X b i	V a l	X a a	P r o	X c d	
X b k	V a l	X a a	P r o	X c c	異性体 1
X b k	V a l	X a a	P r o	X c c	異性体 2
X a x	V a l	X a a	P r o	X b p	異性体 1
X a x	V a l	X a a	P r o	X b p	異性体 2
X b k	V a l	X a a	P r o	X c b	異性体 1
X b k	V a l	X a a	P r o	X c b	異性体 2
X a u	V a l	X a a	P r o	X c c	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c d	

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 10】

X a u	V a l	X a a	P r o	X b p	異性体 1
X a u	V a l	X a a	P r o	X b p	異性体 2
X b k	V a l	X a a	P r o	X c d	

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 11】

X a u	V a l	X a a	P r o	X c h	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c i	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c k	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c l	

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 12】

X a u	V a l	X a a	P r o	X c m	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c n	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c o	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c p	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c q	
X a u	V a l	X a a	P r o	X c r	
X a u	V a l	X a a	P r o	X b r	
X a u	V a l	X a a	X a l	X b x	

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 13】

X a u	V a l	X a a	X a l	X c h	
X a u	V a l	X a a	X a l	X c r	
X a u	V a l	X a a	X a n	X b x	

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 14】

X a u	V a l	X a a	X a n	X c h	
X a u	V a l	X a a	X a n	X c r	
X a u	I l e	X a a	P r o	X b x	
X a u	I l e	X a a	P r o	X c h	

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 15】

X a u X c s X a a P r o X c h

X a u X c s X a a P r o X b x

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。

【請求項 16】

X a u V a l X c t P r o X c h

X a u V a l X c t P r o X b x

から選択される請求項 2 に記載の化合物又は生理学的に適応する酸との塩。