

【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 07 K 7/06 (2006.01)

A 61 K 38/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 07 K 7/06 Z N A

A 61 K 37/02

A 61 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】

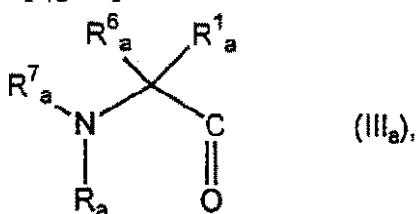
A-B-D-E-F-(G)_r-(K)_s-L,

{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、

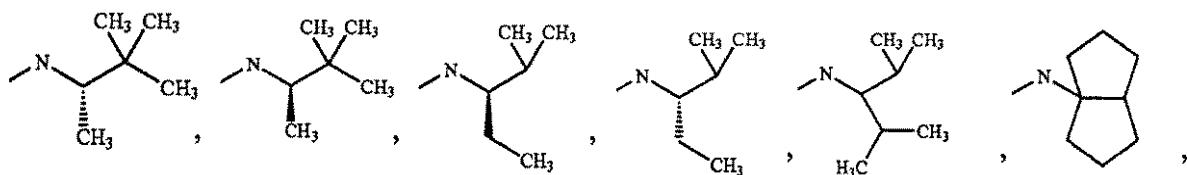
Dが、N-メチルバリン残基又はN-メチルイソロイシン残基を意味し、

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、

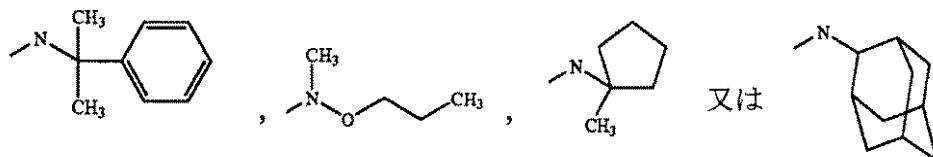
F がプロリルを意味し、

L が、N - ベンジルアミド、N - メトキシ - N - ベンジルアミド、tert - プチルアミド、tert - プチルエステル、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 - プチル、

【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 × HC1、

X a x	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 1
X a x	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 2
X a z	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 1
X a z	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 2
X b b	Val	X a a	Pro	X a b	
X b d	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 1
X b d	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 2
X b g	Val	X a a	Pro	X a b	
X b i	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 1
X b i	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 2
X b k	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 1
X b k	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 2
X b l	Val	X a a	Pro	X a b	
X b m	Val	X a a	Pro	X a b	
X b l	Val	X a a	Pro	X a b	異性体 1
X b l	Val	X a a	Pro	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	

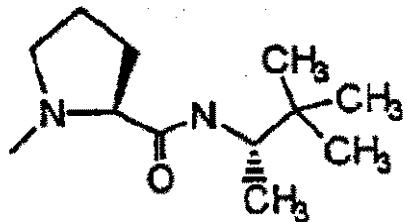
[但し、上記各略号は以下のアミノ酸又はアミノ酸残基を示す：

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

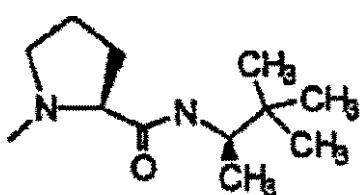
X a u : N , N - ジメチル - 2 - エチル - 2 - フェニルグリシン
 X a x : N , N - ジメチル - 2 - [2 - フルオロ] フェニルグリシン
 X a z : N , N - ジメチル - 2 - [4 - フルオロ] フェニルグリシン
 X b b : 2 - (R , S) - エチル - 2 - フェニルグリシン
 X b d : N , N - ジメチル - 2 - (R , S) - 2 - フェニルグリシン
 X b g : N - イソプロピル - 2 - (R , S) - エチル - 2 - フェニルグリシン
 X b i : N , 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 - プチルアミド
 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:

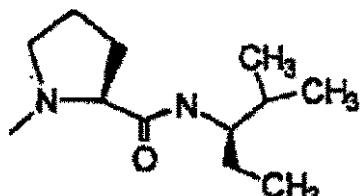


【化 6】

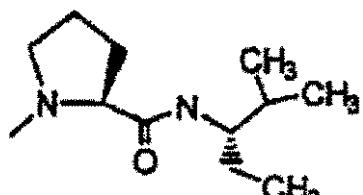
Xci:



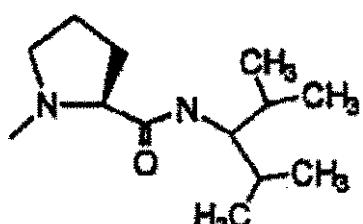
Xck:



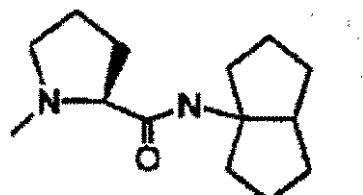
Xcl:



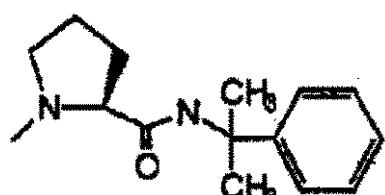
Xcm:



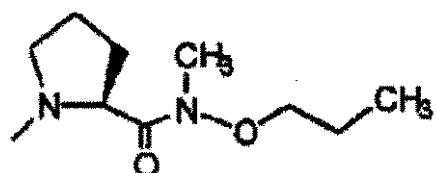
Xcn:



Xco:

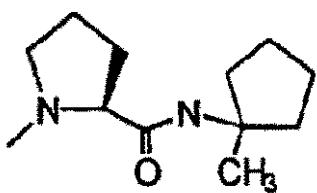


Xcp:

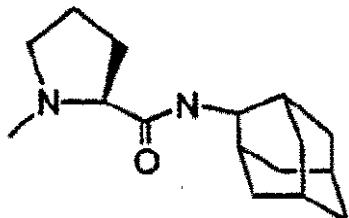


【化7】

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。