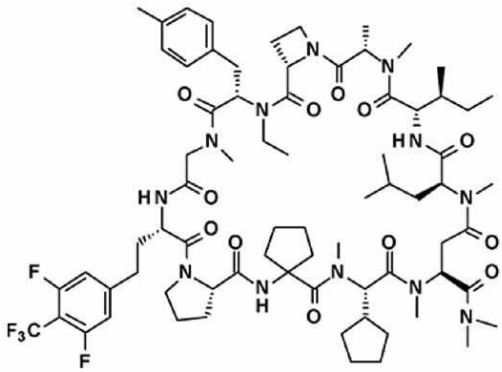
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和5年4月5日(2023.4.5)

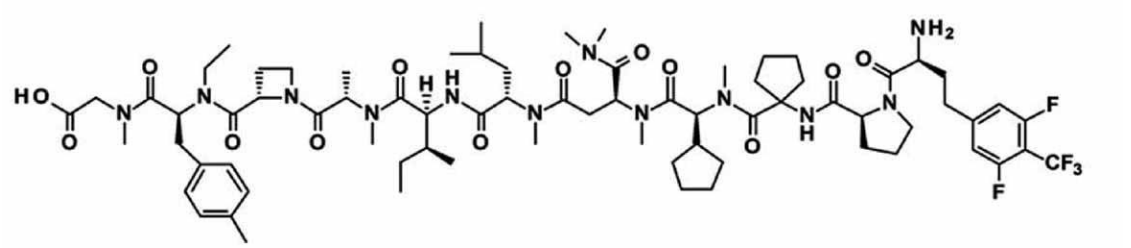
【国際公開番号】WO2022/234864
【出願番号】特願2022-547692(P2022-547692)
【国際特許分類】
C07K 1/02(2006.01)
C07K 7/50(2006.01)
C07K 5/12(2006.01)
【ＦＩ】
C07K 1/02
C07K 7/50
C07K 5/12

【手続補正書】
【提出日】令和4年8月8日(2022.8.8)
【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】
１種または複数種の水と混和しない溶媒、１種または複数種の水溶性アルキルニトリル類、および１種または複数種の水溶性エーテル類からなる群より選択される１つまたは複数を含む溶媒（溶媒A）中、ペプチド化合物のN末端のアミノ酸残基とC末端のアミノ酸残基とを連結する工程を含む、液相法によって、下記式で表される環状ペプチド化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を製造する方法。
【化１】



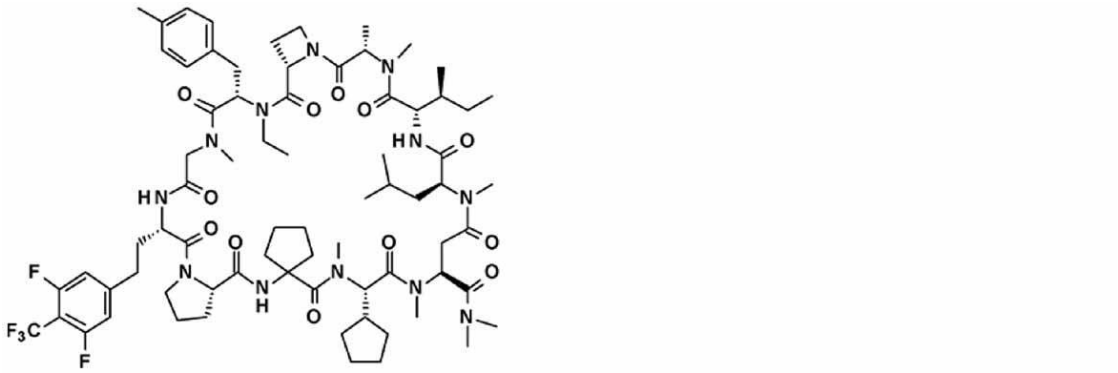
【請求項２】
前記ペプチド化合物のN末端のアミノ酸残基とC末端のアミノ酸残基が、アミド結合によって連結される、請求項１に記載の方法。
【請求項３】
前記ペプチド化合物のC末端のアミノ酸残基またはN末端のアミノ酸残基の一方が、カルボキシル基のα位炭素に不斉炭素を有しないアミノ酸残基である、請求項２に記載の方法。
【請求項４】
前記ペプチド化合物のC末端のアミノ酸残基が、カルボキシル基のα位炭素に不斉炭素を

有しないアミノ酸残基である、請求項３に記載の方法。
【請求項５】
前記ペプチド化合物が、
【化２】



である、請求項４に記載の方法。
【請求項６】
前記環状ペプチド化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物が、環状ペプチド化合物の溶媒和物である、請求項５に記載の方法。
【請求項７】
前記環状ペプチド化合物の溶媒和物が、環状ペプチド化合物の水和物である、請求項６に記載の方法。
【請求項８】
前記環状ペプチド化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物が、環状ペプチド化合物の溶媒和物である、請求項２に記載の方法。
【請求項９】
前記環状ペプチド化合物の溶媒和物が、環状ペプチド化合物の水和物である、請求項８に記載の方法。
【請求項１０】
水と混和しない溶媒が、2-MeTHF、炭酸ジメチル、アニソール、酢酸イソプロピル、酢酸エチル、MTBE、CPME、4-メチルテトラヒドロピラン、ヘプタン、およびトルエンからなる群より選択される溶媒を１つ以上含む、請求項２に記載の方法。
【請求項１１】
水溶性アルキルニトリル類が、アセトニトリル、および／またはプロピオニトリルである、請求項１０に記載の方法。
【請求項１２】
水溶性エーテル類が、THF、1,4-ジオキサン、1,3-ジオキサン、およびジメトキシエタンからなる群より選択される溶媒を１つ以上含む、請求項１１に記載の方法。
【請求項１３】
前記環状ペプチド化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物が、環状ペプチド化合物の水和物である、請求項１２に記載の方法。
【請求項１４】
溶媒Aが、2-MeTHF、THF、4-メチルテトラヒドロピラン、MTBE、CPME、炭酸ジメチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、アニソール、アセトニトリル、ヘプタン、およびトルエンからなる群から選択される溶媒を１つ以上含む、請求項２に記載の方法。
【請求項１５】
環状ペプチド化合物を晶析により単離および／または精製して、環状ペプチド化合物の結晶を得る工程をさらに含む、請求項１～１４のいずれか一項に記載の方法。
【請求項１６】
環状ペプチド化合物の結晶が、下記式：

【化３】



で表される環状ペプチド化合物の非溶媒和物結晶、または溶媒和物結晶である、請求項１５に記載の方法。

【請求項１７】

前記環状ペプチド化合物の結晶が、環状ペプチド化合物の溶媒和物結晶である、請求項１６に記載の方法。

【請求項１８】

環状ペプチド化合物の溶媒和物結晶が水和物結晶である、請求項１７に記載の方法。

【請求項１９】

水和物結晶が、粉末X線回折による回折角（２θ値）として、４．９６４°、７．９２１°、８．２９６°、８．８５５°、９．９５６°、１０．４３５°、１１．７２９°、１２．７０４°、１３．５５２°、１３．９０１°、１５．８９５°、１６．６４３°、および１７．８１３°（±０．２°）からなる群から選択される、少なくとも７個のピークを含むC型結晶である、請求項１８に記載の方法。

【請求項２０】

水和物結晶が、粉末X線回折による回折角（２θ値）として、４．９６４°、７．９２１°、８．２９６°、８．８５５°、９．９５６°、１０．４３５°、１１．７２９°、１２．７０４°、１３．５５２°、１３．９０１°、１５．８９５°、１６．６４３°、および１７．８１３°（±０．２°）からなる群から選択される、少なくとも１０個のピークを含むC型結晶である、請求項１８に記載の方法。

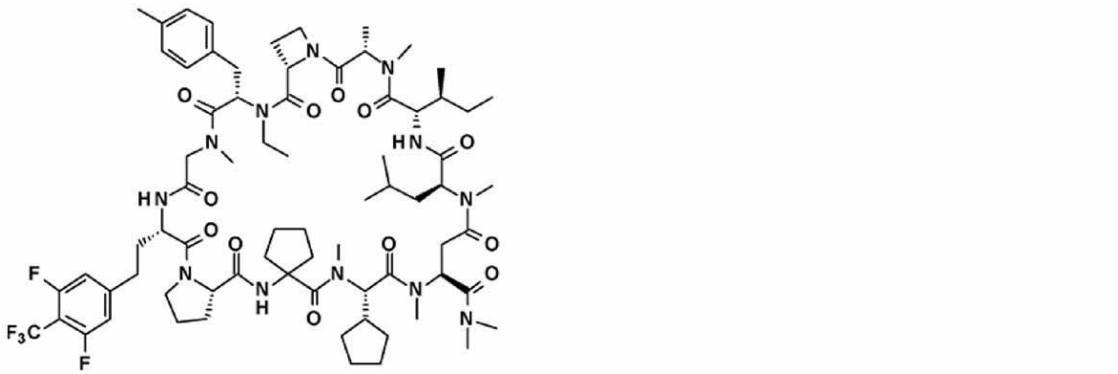
【請求項２１】

水和物結晶が、粉末X線回折による回折角（２θ値）として、４．９６４°、７．９２１°、８．２９６°、８．８５５°、９．９５６°、１０．４３５°、１１．７２９°、１２．７０４°、１３．５５２°、１３．９０１°、１５．８９５°、１６．６４３°、および１７．８１３°（±０．２°）のピークを含むC型結晶である、請求項１８に記載の方法。

【請求項２２】

下記式：

【化４】



で表される環状ペプチド化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物の結晶。
【請求項２３】
結晶が、非溶媒和物結晶、溶媒和物結晶、塩の結晶、および塩の溶媒和物結晶からなる群より選択される、請求項２２に記載の結晶。
【請求項２４】
結晶が、溶媒和物結晶である、請求項２３に記載の結晶。
【請求項２５】
溶媒和物結晶が水和物結晶である、請求項２４に記載の結晶。
【請求項２６】
水和物結晶が、粉末X線回折による回折角（２θ値）として、４．９６４°、７．９２１°、８．２９６°、８．８５５°、９．９５６°、１０．４３５°、１１．７２９°、１２．７０４°、１３．５５２°、１３．９０１°、１５．８９５°、１６．６４３°、および１７．８１３°（±０．２°）からなる群から選択される、少なくとも７個のピークを含むC型結晶である、請求項２５に記載の結晶。
【請求項２７】
水和物結晶が、粉末X線回折による回折角（２θ値）として、４．９６４°、７．９２１°、８．２９６°、８．８５５°、９．９５６°、１０．４３５°、１１．７２９°、１２．７０４°、１３．５５２°、１３．９０１°、１５．８９５°、１６．６４３°、および１７．８１３°（±０．２°）からなる群から選択される、少なくとも１０個のピークを含むC型結晶である、請求項２５に記載の結晶。
【請求項２８】
水和物結晶が、粉末X線回折による回折角（２θ値）として、４．９６４°、７．９２１°、８．２９６°、８．８５５°、９．９５６°、１０．４３５°、１１．７２９°、１２．７０４°、１３．５５２°、１３．９０１°、１５．８９５°、１６．６４３°、および１７．８１３°（±０．２°）のピークを含むC型結晶である、請求項２５に記載の結晶。

–