

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 공개특허공보(A)

(51) Int. Cl. <sup>5</sup> C07K 7/52	(11) 공개번호 특 1992-0009846
	(43) 공개일자 1992년 06월 25일
(21) 출원번호	특 1991-0019015
(22) 출원일자	1991년 10월 29일
(30) 우선권주장	P4034829.6 1990년 11월 02일 독일(DE)
(71) 출원인	메르크 파텐트 게젤샤프트 미트 베슈랭크터 하프퉁 호이만, 쉬틀러 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250
(72) 발명자	권터 홀쯔만 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 알프레드 쟁크지크 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 위르겐 하르팅 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250 하르트무트 그라이너 독일연방공화국 데-6100 다름스타트 프랑크푸르터 스트라세 250
(74) 대리인	송재련, 한규환, 김동완
<b>심사청구 : 없음</b>	

(54) 시클로펩티드

**요약**

내용 없음

**명세서**

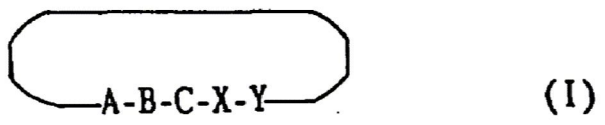
[발명의 명칭]  
시클로펩티드  
[도면의 간단한 설명]

"본 내용은 요부공개 건이므로 전문내용을 수록하지 않았음"

**(57) 청구의 범위**

**청구항 1**

다음 일반식 (I)의 신규한 시클로펩티드 및 이의 염.



상기 식에서, A는 Asn, Asp(OR), Gln, Glu(OR), Hypro, Lys, Orn, Ser 또는 Thr이고, B 및 C는 각기 N<sub>α</sub>-Mephe, N<sub>α</sub>-MeTrp, Phe, Tcc, Tic, Trp 또는 Tyr이고, X는 Gly, (S,S)-Gly[ANC-2]-Leu, 또는 A가 Gln이 아니면, 또한 Gly-Leu이고 Y는 Leu, Met, Met(O), Met(O<sub>2</sub>) 또는 Nie이고, X-Y는 함께 또한 Gly-Leu(red)-Leu이고, R은 H, 탄소수 1 내지 4의 알킬 또는 벤질이다.

**청구항 2**

a) Cyclo[-Gln-Trp-Phe-Gly-D-Met-], b) Cyclo[-Hypro-Trp-Phe-Gly-Leu-Met-], c) Cyclo[-Hypro-Trp-Phe-Gly-Leu-D-Met-].

**청구항 3**

제1항에 따른 일반식(1)의 시클로펩티드를 제조하는 방법에 있어서, 그의 작용성 유도체중 하나로부터 가용매분해제 또는 가수소분해제로 처리하여 유리시키거나 또는 다음 일반식(1)의 펩티드 또는 이 펩티드의 반응성 유도체를 폐환제로 처리하고, 필요시 일반식(1)의 화합물에서 티오에테르 그룹을 술폭시드 그룹 또는 술포그룹으로 산화시키고/시키거나, 일반식(1)의 화합물을 산으로 처리하여 이의 염중 하나로 전환시킴을 특징으로 하는 제1항의 일반식(1)의 시클로펩티드 제조방법.

H-Z-아

상기 식에서, Z는 A-B-C-X-Y, B-C-X-Y-A, C-X-Y-A-B, X-Y-A-B-C, Leu-Y-A-B-C-Gly, Y-A-B-C-X 또는 Leu(red)-Leu-A-B-C-Gly이다.

**청구항 4**

일반식(1)의 화합물 및/또는 이의 생리학적으로 허용 가능한 염중 하나를 적어도 하나의 고체, 액체 또는 반-액체 부형제 또는 보조제와 함께 적절한 투여형을 전환시킴을 특징으로 하는 약제학적 제형의 제조방법.

**청구항 5**

적어도 하나의 일반식(1)의 화합물 및/또는 이의 생리학적으로 허용 가능한 염중 하나를 함유하는 것을 특징으로 하는 약제학적 제형.

**청구항 6**

약물을 제조하기 위한 일반식(1)의 화합물 또는 이의 생리학적으로 허용 가능한 염의 용도.

**청구항 7**

심장혈관 장애, 경련장애, 고통상태, 염증, 중추신경계 및/또는 순환계 및/또는 눈물분비의 자극의 장애를 억제하는데 있어서의 일반식(1)의 화합물 또는 이의 생리학적으로 허용가능한 염의 용도.

※참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.