【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2004-537596(P2004-537596A)
【公表日】平成16年12月16日(2004.12.16)
【年通号数】公開・登録公報2004-049
【出願番号】特願2003-519026(P2003-519026)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｋ　7/00　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ 277/08　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ 279/12　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ 279/14　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　5/00　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　5/11　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　5/12　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　7/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　7/06　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　7/50　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　7/64　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ 14/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 47/42　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｋ　7/00　ＺＮＡ
Ｃ０７Ｃ 277/08
Ｃ０７Ｃ 279/12
Ｃ０７Ｃ 279/14
Ｃ０７Ｋ　5/00
Ｃ０７Ｋ　5/11
Ｃ０７Ｋ　5/12
Ｃ０７Ｋ　7/04
Ｃ０７Ｋ　7/06
Ｃ０７Ｋ　7/50
Ｃ０７Ｋ　7/64
Ｃ０７Ｋ 14/00
Ａ６１Ｋ 47/42

【手続補正書】
【提出日】平成17年8月1日(2005.8.1)
【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】
オリゴグアニジン化合物を調製するための方法であって、該方法は、以下：
（ａ）複数の化学的に結合されたアミンを有するオリゴマーと保護基除去剤とを接触させて該保護基を除去し、複数の化学的に結合されたアミンを有するオリゴマーを生成する工程であって、ここで、該結合されたアミンの一部は、保護基に結合されている、工程；

および
（ｂ）該複数の化学的に結合されたアミンを有するオリゴマーをピラゾール－１－カルボキサミジンの塩と接触させて該化学的に結合された各アミンをグアニジニル基に転換し、オリゴグアニジン化合物を生成する工程；
を包含し、ここで、該オリゴマーは、（ａ）または（ｂ）の接触させる工程の間、固体支持体に化学的に結合されていない、方法。
【請求項２】
前記化学的に結合された各アミン上の保護基が、トリフルオロアセチル基である、請求項１に記載の方法。
【請求項３】
前記接触させる工程の両方が、単一の反応容器中で行なわれる、請求項１に記載の方法。
【請求項４】
前記接触させる工程が、連続的に実施される、請求項１に記載の方法。
【請求項５】
前記接触させる工程が、同時に実施される、請求項１に記載の方法。
【請求項６】
前記オリゴマーが、ペプチド骨格を有する、請求項１に記載の方法。
【請求項７】
前記ペプチド骨格が、環状ペプチド骨格である、請求項６に記載の方法。
【請求項８】
前記オリゴマーが、オリゴオルニチン化合物である。請求項６に記載の方法。
【請求項９】
前記オリゴオルニチン化合物が、オクタオルニチン化合物であり、そして、２つのテトラオルニチン化合物のカップリングによって生成される、請求項８に記載の方法。
【請求項１０】
前記テトラオルニチン化合物の各々が、２つのオルニチンダイマーのカップリングによって生成される、請求項９に記載の方法。
【請求項１１】
前記オリゴマーが、ペプトイド、ポリ－ｐ－フェニレン、ポリエチレングリコール、ペプチド－ペプトイドハイブリッド、ポリアミド、アザペプチド、ペプチド－尿素ハイブリッド、ポリエナミン、ポリオキサミド、炭化水素、ポリエチレン／ポリプロピレンエーテル、炭水化物およびオキシ置換されたジクロロヘキシエーテルからなる群から選択される非ペプチド骨格を有する、請求項１に記載の方法。
【請求項１２】
前記非ペプチド骨格が、環状非ペプチド骨格である、請求項１１に記載の方法。
【請求項１３】
前記オリゴグアニジン化合物が、少なくとも４つのアルギニン残基を有する、請求項１に記載の方法。
【請求項１４】
前記オリゴグアニジン化合物が、少なくとも６個のアルギニン残基を有する、請求項１３に記載の方法。
【請求項１５】
前記オリゴグアニジン化合物が、連続した少なくとも８個のアルギニン残基を含む、請求項１４に記載の方法。
【請求項１６】
前記オリゴグアニジン化合物が、Ｄ－アルギニンまたはＬ－アルギニンのオクタマーである、請求項１５に記載の方法。
【請求項１７】
前記オリゴグアニジン化合物が、連続していない４～８個のアルギニン残基を含む、請

求項１３に記載の方法。
【請求項１８】
前記オリゴグアニジン化合物が、基本的には、８個～１６個のアミノ酸残基から構成されており、ここで、４個～８個の該アミノ酸残基がアルギニン残基である、請求項１に記載の方法。
【請求項１９】
前記アルギニン残基が、Ｄ－アルギニン、Ｌ－アルギニン、Ｄ－ホモアルギニンおよびＬ－ホモアルギニンからなる群から選択される、請求項１３に記載の方法。
【請求項２０】
前記アルギニン残基が、Ｄ－アルギニンおよびＬ－アルギニンからなる群から選択される、請求項１９に記載の方法。
【請求項２１】
請求項１に記載の方法であって、前記オリゴグアニジン化合物が、$(X^0-Arg-X^0)_q$および$(X^0-Arg)_q$からなる群から選択される式を有し、ここで、各X^0は、グアニジノ部分を有さないアミノ酸残基であり；Ａｒｇは、Ｄ－アルギニン、Ｌ－アルギニン、Ｄ－ホモアルギニンおよびＬ－ホモアルギニンからなる群から選択され；そしてｑは、２、４、６、８および１６から選択される整数である、方法。
【請求項２２】
前記オリゴグアニジン化合物が、式$(X^0-Arg-X^0)_q$を有する、請求項２１に記載の方法。
【請求項２３】
前記オリゴグアニジン化合物が、式$(X^0-Arg)_q$を有する、請求項２１に記載の方法。
【請求項２４】
前記アルギニン残基の側鎖が改変されている、請求項１３に記載の方法。
【請求項２５】
前記アルギニン残基の側鎖が、Ｃ誘導体、Ｏ誘導体、Ｎ誘導体、Ｓ誘導体またはＢ誘導体を含むように改変されている、請求項２２に記載の方法。
【請求項２６】
前記アルギニン残基の側鎖が、２重結合または３重結合を含むように改変されている、請求項２４に記載の方法。
【請求項２７】
前記アルギニン残基の側鎖が、環状構造を含むように改変されている、請求項２４に記載の方法。
【請求項２８】
前記グアニジニル基が改変されている、請求項１に記載の方法。
【請求項２９】
請求項１に記載の方法であって、前記オリゴグアニジン化合物を塩に転換する工程をさらに包含する、方法。
【請求項３０】
前記塩が、ポリトリフルオロ酢酸塩である、請求項２９に記載の方法。
【請求項３１】
請求項１に従って調製されるオリゴグアニジン化合物を含む化合物であって、該オリゴグアニジン化合物は、治療剤に化学的に結合されている、化合物。
【請求項３２】
請求項１９に従って調製されるオリゴグアニジン化合物を含む化合物であって、該オリゴグアニジン化合物は、治療剤に化学的に結合されている、化合物。
【請求項３３】
適切に保護されたオルニチンモノマーからオリゴアルギニン化合物を調製する方法であって、該方法は、以下：

（ａ）適切に保護された２つの異なるオルニチンモノマーをカップリングして直交的に保護されたカップリングされたオルニチン化合物を生成する、工程；
（ｂ）該直交的に保護されたカップリングされたオルニチン化合物を２つの部分に分割し、そしてアミドカップリングのために該部分の各々を活性化して２つの独立して活性化されたカップリングされたオルニチン化合物を生成する工程；
（ｃ）前記２つの独立して活性化されたカップリングされたオルニチン化合物を、アミドカップリングに十分な条件下で再結合し、新しい、直交的に保護されたカップリングされたオルニチン化合物を生成する工程；
（ｄ）工程（ｃ）の生成物を、該分割する工程、活性化する工程および再結合する工程に０～３回供して、線状構成で４個、８個または１６個のオルニチンモノマーを有するオリゴオルニチン化合物を生成する、工程；および
（ｅ）該オリゴオルニチン化合物とペルグアニジル化試薬とを、オリゴアルギニン化合物を生成するのに十分な条件下で接触させる工程、
を包含する、方法。
【請求項３４】
前記オリゴグアニジン化合物が、連続した少なくとも８個のアルギニン残基を含む、請求項３３に記載の方法。
【請求項３５】
前記オリゴアルギニン化合物が、Ｄ－アルギニンのオクタマーである、請求項３４に記載の方法。
【請求項３６】
請求項３３に記載の方法であって、前記オリゴアルギニン化合物が、$(X^0-Arg-X^0)_t$および$(X^0-Arg)_t$からなる群から選択される式を有し、ここで、各X^0は、グアニジノ部分を有さないアミノ酸残基であり；Ａｒｇは、Ｄ－アルギニンおよびＬ－アルギニンからなる群から選択され；そしてｔは、４、８および１６から選択される整数である、方法。
【請求項３７】
各X^0が、グリシン、β－アラニン、４－アミノ酪酸、５－アミノ吉草酸、および６－アミノカプロン酸からなる群から選択される、請求項３３に記載の方法。
【請求項３８】
前記オリゴアルギニン化合物が、式$(X^0-Arg)_t$を有し、そして各X^0が、グリシン、β－アラニン、４－アミノ酪酸、５－アミノ吉草酸、および６－アミノカプロン酸からなる群から選択される、請求項３３に記載の方法。
【請求項３９】
前記オリゴアルギニン化合物が、式$(X^0-Arg)_t$を有し、そして各X^0が、グリシン、β－アラニン、４－アミノ酪酸、５－アミノ吉草酸、および６－アミノカプロン酸からなる群から選択され、そしてｔが８または１６であるる、請求項３３に記載の方法。