

【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28年5月12日 (2016.5.12)

【公開番号】特開2015-131856(P2015-131856A)

【公開日】平成27年7月23日 (2015.7.23)

【年通号数】公開・登録公報2015-046

【出願番号】特願2015-86575(P2015-86575)

【国際特許分類】

C 0 7 K 14/58 (2006.01)

C 0 7 K 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 14/58

C 0 7 K 9/00 Z N A

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 27/06

A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成28年3月16日 (2016.3.16)

【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

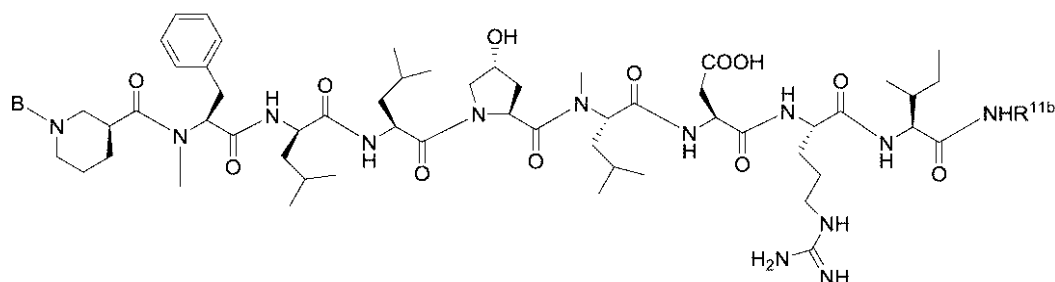
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【化 1】



の化合物であって、

ここで、Bは、 $R^{b1}$  - および  $R^{b2}$  - C(O) - からなる群から選択され、ここで、

$R^{b1}$ は、 $C_6 \sim C_{10}$ アルキルおよび  $NR^{b4}R^{b5}$ によって置換された  $C_6 \sim C_{10}$ アルキルからなる群から選択され；

$R^{b2}$ は、 $C_6 \sim C_{10}$ アルキルおよび  $NR^{b4}R^{b5}$ によって置換された  $C_6 \sim C_{10}$ アルキルからなる群から選択され；そして

$R^{b4}$ および  $R^{b5}$ は、独立して、Hおよび  $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択され；そして

$R^{11b}$ は、H、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ビシクロアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ シクロアルキルアリールおよび  $C_1 \sim C_4$ アルキル -  $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルからなる群から選択される、化合物。

【請求項2】

Bが  $R^{b2}$  - C(O) - であり、かつ  $R^{b2}$ が  $C_6 \sim C_{10}$ アルキルであり；そして

$R^{11b}$ が、Hおよび  $C_1 \sim C_8$ アルキルからなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

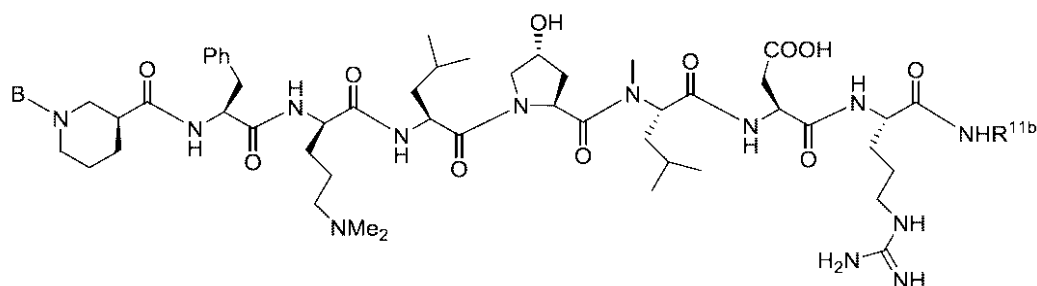
Occ-Sni-Nmf-Ile-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH<sub>2</sub> (配列番号436)

である、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

式：

【化2】



の化合物であって、ここでBは、 $R^{b1}$  - および  $R^{b2}$  - C(O) - からなる群から選択され、ここで、

$R^{b1}$ は、 $C_6 \sim C_{10}$ アルキルおよび  $NR^{b4}R^{b5}$ によって置換された  $C_6 \sim C_{10}$ アルキルからなる群から選択され；

$R^{b2}$ は、 $C_6 \sim C_{10}$ アルキルおよび  $NR^{b4}R^{b5}$ によって置換された  $C_6 \sim C_{10}$ アルキルからなる群から選択され；そして

$R^{b4}$ および  $R^{b5}$ は、独立して、Hおよび  $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択され；そして

$R^{11b}$ は、H、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ ビシクロアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$ シクロアルキルアリールおよび  $C_1 \sim C_4$ アルキル -  $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルからなる群から選択される、化合物。

【請求項5】

Bが  $R^{b2}$  - C(O) - であり、かつ  $R^{b2}$ が  $C_6 \sim C_{10}$ アルキルであり；そして

$R^{11b}$ が、H、 $C_1 \sim C_8$ アルキルおよび  $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルからなる群から選択される、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

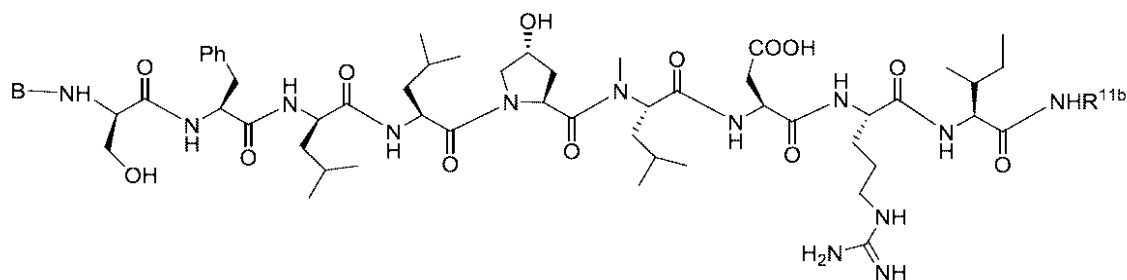
Occ-Sni-Phe-orn(Me<sub>2</sub>)-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Che (配列番号518)

である、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

式：

## 【化 3】



の化合物であって、ここで、Bは、 $R^{b1}$  - および  $R^{b2} - C(O) -$  からなる群から選択され、ここで、

$R^{b1}$  は、 $C_6 \sim C_{10}$  アルキルおよび  $NR^{b4}R^{b5}$  によって置換された  $C_6 \sim C_{10}$  アルキルからなる群から選択され；

$R^{b2}$  は、 $C_6 \sim C_{10}$  アルキルおよび  $NR^{b4}R^{b5}$  によって置換された  $C_6 \sim C_{10}$  アルキルからなる群から選択され；そして

$R^{b4}$  および  $R^{b5}$  は、独立して、H および  $C_1 \sim C_4$  アルキルからなる群から選択され；そして

$R^{11b}$  は、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  ビシクロアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  シクロアルキルアリールおよび  $C_1 \sim C_4$  アルキル -  $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルからなる群から選択される、化合物。

## 【請求項 8】

Bが  $R^{b2} - C(O) -$  であり、かつ  $R^{b2}$  が  $C_6 \sim C_{10}$  アルキルであり；そして

$R^{11b}$  が、H および  $C_1 \sim C_8$  アルキルからなる群から選択される、請求項 7 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

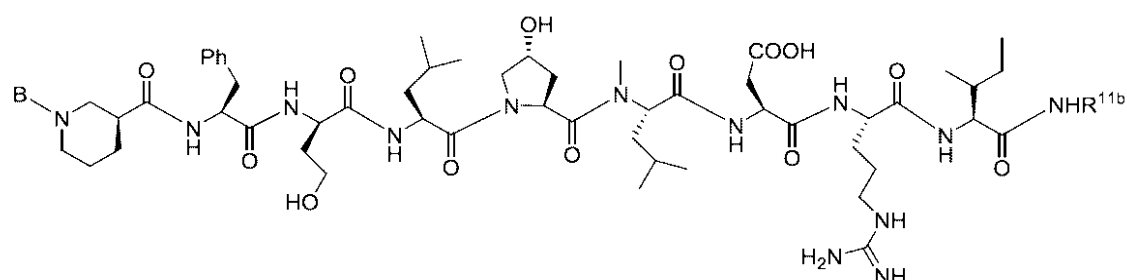
Occ-ser-Phe-Ileu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH<sub>2</sub> (配列番号530)

である、請求項 8 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

式：

## 【化 4】



の化合物であって、ここでBは、 $R^{b1}$  - および  $R^{b2} - C(O) -$  からなる群から選択され、ここで、

$R^{b1}$  は、 $C_6 \sim C_{10}$  アルキルおよび  $NR^{b4}R^{b5}$  によって置換された  $C_6 \sim C_{10}$  アルキルからなる群から選択され；

$R^{b2}$  は、 $C_6 \sim C_{10}$  アルキルおよび  $NR^{b4}R^{b5}$  によって置換された  $C_6 \sim C_{10}$  アルキルからなる群から選択され；そして

$R^{b4}$  および  $R^{b5}$  は、独立して、H および  $C_1 \sim C_4$  アルキルからなる群から選択され；そして

$R^{11b}$  は、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_4 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  ビシクロアルキル、 $C_7 \sim C_{12}$  シクロアルキルアリールおよび  $C_1 \sim C_4$  アルキル -  $C_4 \sim C_8$  シクロアルキルからなる群から選択される、化合物。

## 【請求項 11】

Bが  $R^{b2} - C(O) -$  であり、かつ  $R^{b2}$  が  $C_6 \sim C_{10}$  アルキルであり；そして

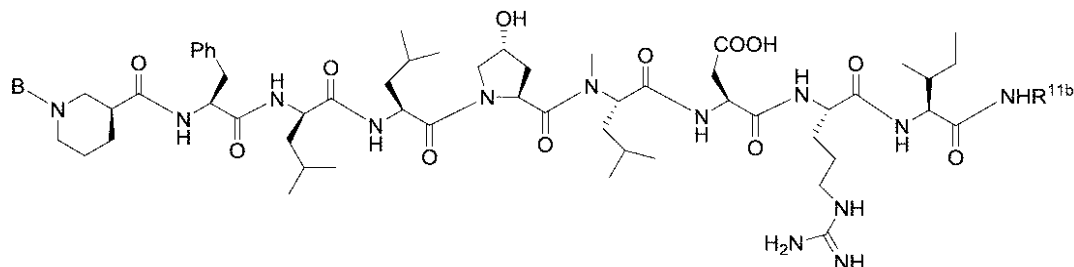
○

1

下

1

1



—

か

か

c

1

---

7

で

1

1

## 【化 6】

Oct-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 278);
Sbt-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 345);
Nbt-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 346);
1319-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 455);
1320-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 456);
2553-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 457);
4734-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 458);
4703-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 459);
6988-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 460);
Hex-(3421)-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 461);
1695-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 462);
779-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 483);
785-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 484);
1281-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 485);
3218-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 486);
6013-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 487);
5587-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 488);
1281-G-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 489);
1281-Bal-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 490);
Gluc-Aoa-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 532);
Gluc-Aoa-hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 533);
(1913)-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 534);
(1270)-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 535);
(1888)-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 536);
Occ-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 537);
H-Adx-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 538);
1888-hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 539);
H-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 577);
H-hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 578);
H-Lys-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 579);
H-Lys-hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 580);
H-Lys-Pro-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 581);
(2857-Ac)-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 582);
(1625-Ac)-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH <sub>2</sub> (配列番号 583); および
Occ-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-OH (配列番号 599).

から選択される化合物。

## 【請求項 18】

H-Adx-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH<sub>2</sub> (配列番号 538)

である、請求項 17 に記載の化合物。

## 【請求項 19】

式：

Bc1ccncc1C(=O)N[C@@H](Cc2ccccc2)C(=O)N[C@@H](CCCCN(C)C)C(=O)N[C@@H](C3CC(C)CC3C(=O)N[C@@H](O)C(=O)N[C@@H](C(C)C)C(=O)N[C@@H](Cc4ccccc4)C(=O)O[C@H](C(=O)N[C@@H](C(C)C)C(=O)N[C@@H](C(C)C)C(=O)NHR11b)C(=O)O

請求項1～21のいずれかに記載の化合物および1つ以上の賦形剤を含む組成物。