

【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 07 K 14/58 (2006.01)

C 07 K 9/00 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 K 38/00 (2006.01)

【F I】

C 07 K 14/58

C 07 K 9/00 Z N A

A 61 P 27/02

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 13/12

A 61 P 29/00

A 61 P 9/00

A 61 P 25/00

A 61 P 27/06

A 61 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

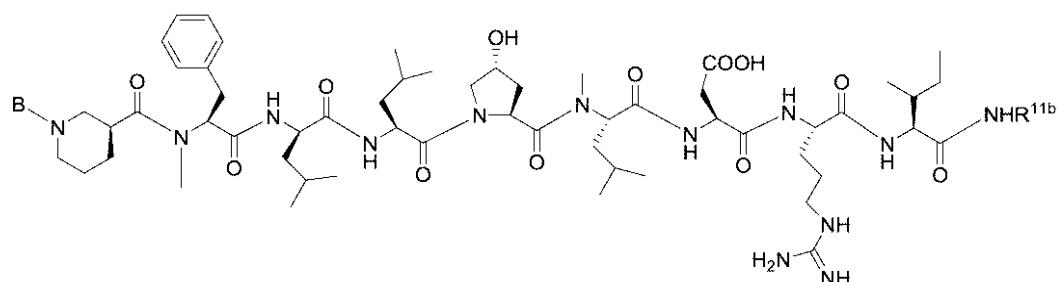
【補正の内容】

【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、C₆ ~ C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆ ~ C₁₀アルキルからなる群から選択され；

R^{b2}は、C₆ ~ C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆ ~ C₁₀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C₁ ~ C₄アルキルからなる群から選択され；そして
R^{11b}は、H、C₁ ~ C₈アルキル、C₄ ~ C₈シクロアルキル、C₇ ~ C₁₂ビシクロアルキル、C₇ ~ C₁₂シクロアルキルアリールおよびC₁ ~ C₄アルキル - C₄ ~ C₈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C₆ ~ C₁₀アルキルであり；そして

R^{11b}が、HおよびC₁ ~ C₈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】

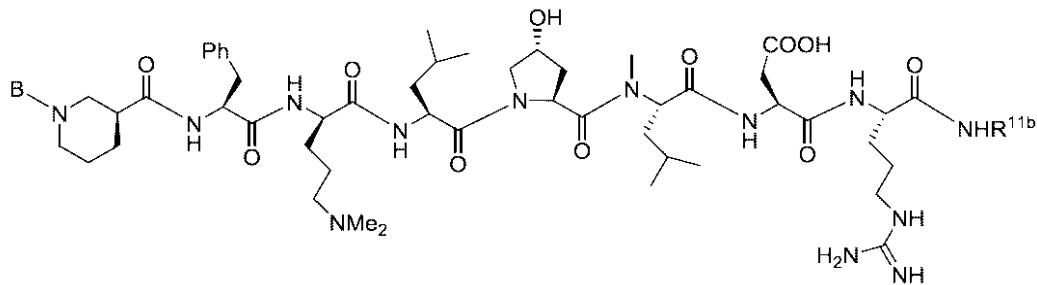
Occ-Sni-Nmf-Ieu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH₂ (配列番号 436)

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、C₆ ~ C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆ ~ C₁₀アルキルからなる群から選択され；

R^{b2}は、C₆ ~ C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆ ~ C₁₀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C₁ ~ C₄アルキルからなる群から選択され；そして

R^{11b}は、H、C₁ ~ C₈アルキル、C₄ ~ C₈シクロアルキル、C₇ ~ C₁₂ビシクロアルキル、C₇ ~ C₁₂シクロアルキルアリールおよびC₁ ~ C₄アルキル - C₄ ~ C₈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C₆ ~ C₁₀アルキルであり；そして

R^{11b}が、H、C₁ ~ C₈アルキルおよびC₄ ~ C₈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】

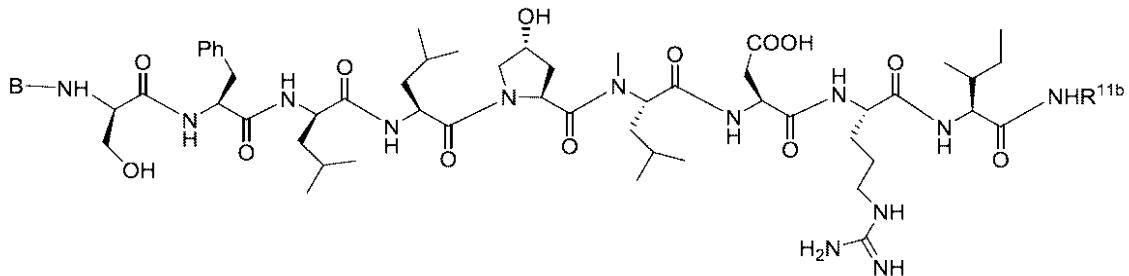
Occ-Sni-Phe-orn(Me2)-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Che (配列番号 518)

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、C₆ ~ C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆ ~ C₁₀アルキルからなる群から選択され；

R^{b2}は、C₆ ~ C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆ ~ C₁₀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C₁ ~ C₄アルキルからなる群から選択され；そして

R^{11b}は、H、C₁ ~ C₈アルキル、C₄ ~ C₈シクロアルキル、C₇ ~ C₁₂ビシクロアルキル、C₇ ~ C₁₂シクロアルキルアリールおよびC₁ ~ C₄アルキル - C₄ ~ C₈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C₆ ~ C₁₀アルキルであり；そしてR^{11b}が、HおよびC₁ ~ C₈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。

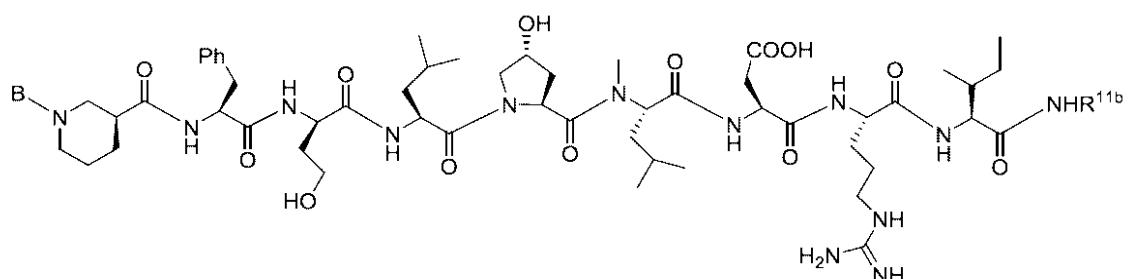
【請求項9】

Occ-ser-Phe-Ieu-Leu-Hyp-NmI-Asp-Arg-Ile-NH₂ (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、C₆ ~ C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆ ~ C₁₀アルキルからなる群から選択され；

R^{b2}は、C₆ ~ C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆ ~ C₁₀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C₁ ~ C₄アルキルからなる群から選択され；そして

R^{11b}は、H、C₁ ~ C₈アルキル、C₄ ~ C₈シクロアルキル、C₇ ~ C₁₂ビシクロアルキル、C₇ ~ C₁₂シクロアルキルアリールおよびC₁ ~ C₄アルキル - C₄ ~ C₈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C₆ ~ C₁₀アルキルであり；そして

R^{11b}が、HおよびC₁～C₈アルキルからなる群から選択される、請求項10に記載の化合物。

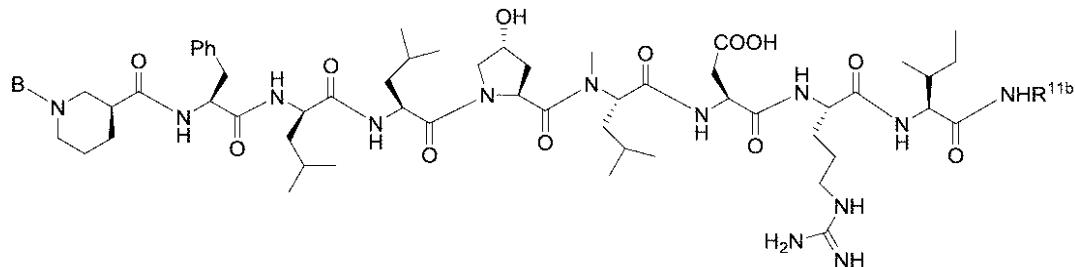
【請求項12】

Occ-Sni-Phe-hse-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH₂ (配列番号560)
である、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

式：

【化5】



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、C₆～C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆～C₁₀アルキルからなる群から選択され；

R^{b2}は、C₆～C₁₀アルキルおよびNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆～C₁₀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C₁～C₄アルキルからなる群から選択され；そして

R^{11b}は、H、C₁～C₈アルキル、C₄～C₈シクロアルキル、C₇～C₁₂ビシクロアルキル、C₇～C₁₂シクロアルキルアリールおよびC₁～C₄アルキル-C₄～C₈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14】

BがR^{b2} - C(O) - であり、かつR^{b2}がC₆～C₁₀アルキルであり；そして
R^{11b}が、HおよびC₁～C₈アルキルからなる群から選択される、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

Occ-Sni-Phe-Ieu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH₂ (配列番号182)
である、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

BがR^{b2} - C(O) - であり、かつR^{b2}がNR^{b4}R^{b5}によって置換されたC₆～C₁₀アルキルであり；

R^{b4}およびR^{b5}が、独立して、HおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択され；そして

R^{11b}が、HおよびC₁～C₈アルキルからなる群から選択される、請求項13に記載の化合物。

【請求項17】

化合物であって、

【化6】

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

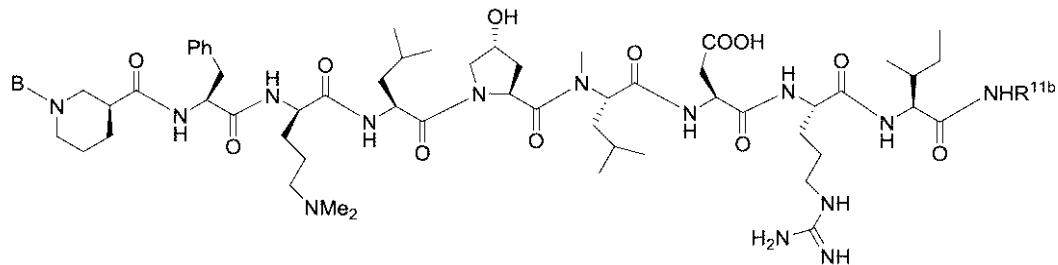
H-Adx-Hgl-Sni-Phe-leu-Leu-Hyp-Nml-Asp-Arg-Ile-NH₂ (配列番号 538)

である、請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

式:

【化7】



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

R^{b2} は、 C_6 ~ C_{10} アルキルおよび $NR^{b4}R^{b5}$ によって置換された C_6 ~ 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 ~ 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 ~ C_8 アルキル、 C_4 ~ C_8 シクロアルキル、 C_7 ~ C_{12} ビシクロアルキル、 C_7 ~ C_{12} シクロアルキルアリールおよび C_1 ~ C_4 アルキル - C_4 ~ 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20】

B が R^{b2} - C(O) - であり、かつ R^{b2} が C_6 ~ C_{10} アルキルであり；そして R^{11b} が、Hおよび C_1 ~ C_8 アルキルからなる群から選択される、請求項19に記載の化合物。

【請求項21】

Occ-Sni-Phe-orn(Me2)-Leu-Hyp-NmI-Asp-Arg-Ile-NH₂ (配列番号269)
である、請求項20に記載の化合物。

【請求項22】

眼内圧を低下させることを必要とする対象において眼内圧を低下させるための、請求項1 ~ 21のいずれかに記載の化合物を含む組成物。

【請求項23】

前記眼内圧が緑内障と関連する、請求項22に記載の組成物。

【請求項24】

眼疾患を処置することを必要とする対象において眼疾患を処置するための、請求項1 ~ 21のいずれかに記載の化合物を含む組成物であって、該眼疾患が緑内障、高い眼内圧または高眼圧症である、組成物。

【請求項25】

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。