

【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17年2月10日(2005.2.10)

【公表番号】特表2000-516592(P2000-516592A)

【公表日】平成12年12月12日(2000.12.12)

【出願番号】特願平10-508666

【国際特許分類第7版】

C 0 7 K 7/06

A 6 1 K 38/04

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 35/00

C 0 7 K 7/64

【F I】

C 0 7 K 7/06

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 35/00

C 0 7 K 7/64

A 6 1 K 37/43

【手続補正書】

【提出日】平成16年4月28日(2004.4.28)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手続補正書

平成16年4月28日

特許庁長官 殿

1. 事件の表示

平成10年特許願第508666号

2. 補正をする者

名 称 ペプター, リミテッド

3. 代理人

住 所 東京都港区虎ノ門1丁目17番1号
虎ノ門5森ビル3階

電話番号 03 (3503) 8637

氏 名 (9109) 弁理士 平木 祐輔



4. 補正対象書類名

請求の範囲

5. 補正対象項目名

請求の範囲

6. 補正の内容

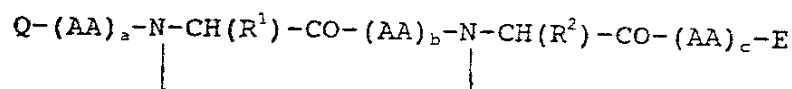
請求の範囲を別紙のとおり補正します。



(別紙)

請求の範囲

1. 一般式 (I) :



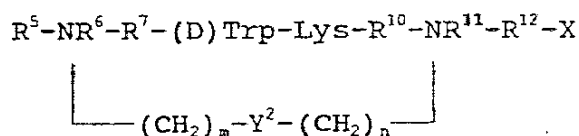
式 (I)

[式中、 $a \sim c$ はそれぞれが独立に 1 ～ 8 の整数または 0 を表し；(AA) はアミノ酸残基を表し、その際、各鎖中のアミノ酸残基は同じでも異なっているてもよく；Q は H またはアシル基を表し；E はヒドロキシル基、カルボキシル保護基またはアミノ基を表し、また、末端カルボキシル基は CH_2-OH に還元されていることができ； R^1 および R^2 はそれぞれ、特定の保護基と結合しているてもよいアミノ酸側鎖を表し；そして線は式： $-(CH_2)_x-M-(CH_2)_y-$ の架橋基を表し；ここで M はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれ； x および y はそれぞれが独立に 1 ～ 10 の整数を表す]

を有する、主鎖環化ソマトスタチン類似体。

2. (AA)_a が、1 以上の、Gly、(D)-もしくは (L)-Ala、(D)-もしくは (L)-Phe、Nal、または β -Asp(Ind) を表し、 a は、0、1 または 2 であり；(AA)_b が、1 以上の、D-Trp、Lys、Phe、Tyr、Gly、Abu、Thr または Val を表し、 b は、1、2、3 または 4 であり；(AA)_c が、1 以上の、Gly、Abu、Thr、Val、(D)-もしくは (L)-Phe、または Nal を表し、 c は、1、2 または 3 である、請求項 1 に記載の主鎖環化ソマトスタチン類似体。

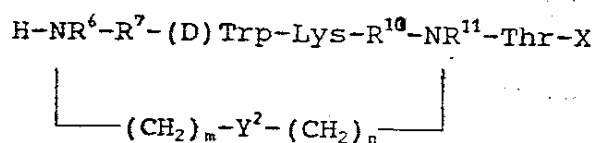
3. 一般式 (Va) :



式 (Va)

[式中、 m および n は 1 ～ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまたはカルボキシ末端アルコールを表し； R^5 は存在しないかまたは Gly、(D)-もしくは (L)-Ala、(D)-もしくは (L)-Phe、Nal および β -Asp (Ind) であり； R^6 および R^{11} は独立に Gly または (D)-もしくは (L)-Phe であり； R^7 は Phe または Tyr であり； R^{10} は存在しないかまたは Gly、Abu、Thr もしくは Val であり； R^{12} は存在しないかまたは Val、Thr もしくは Nal であり； Y^2 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]；

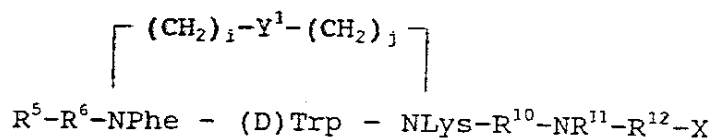
一般式 (Vb)：



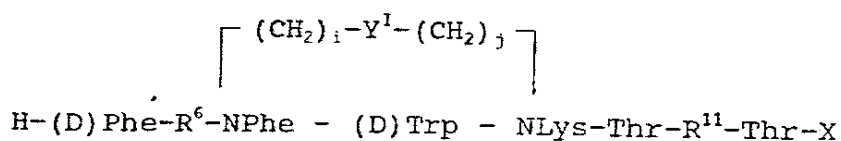
式 (Vb)

[式中、 m および n は 1 ～ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまたはカルボキシ末端アルコールを表し； R^6 および R^{11} は独立に Gly または (D)-もしくは (L)-Phe であり； R^7 は Phe または Tyr であり； R^{10} は存在しないかまたは Gly、Abu、Thr もしくは Val であり； Y^2 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]；

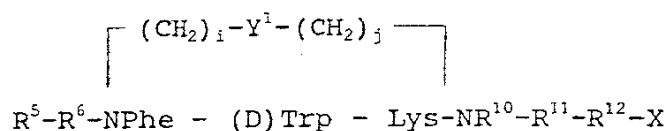
一般式 VI (a, b) および VII (a-c)：



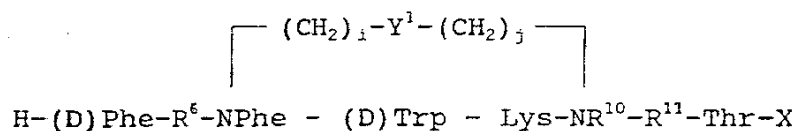
式 (VIa)



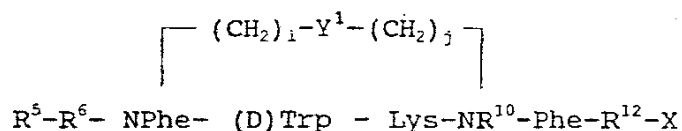
式 (VIb)



式 (VIIa)



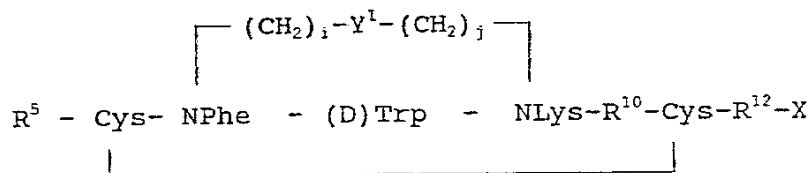
式 (VIIb)



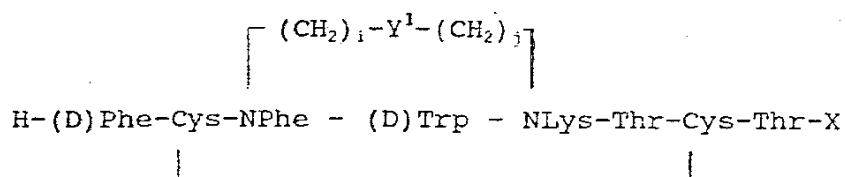
式 (VIIc)

[上記各式中、 i および j は独立に 1 ~ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまたはカルボキシ末端アルコールを表し； R^5 は存在しないか、(D)-もしくは(L)-Phe、Nal、または β -Asp(Ind) であり； R^6 は(D)-または(L)-Phe であり； R^{10} は存在しないか、Gly、Abu、または Thr であり； R^{11} は(D)-または(L)-Phe であり； R^{12} は存在しないか、Thr または Nal であり； Y^1 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]；

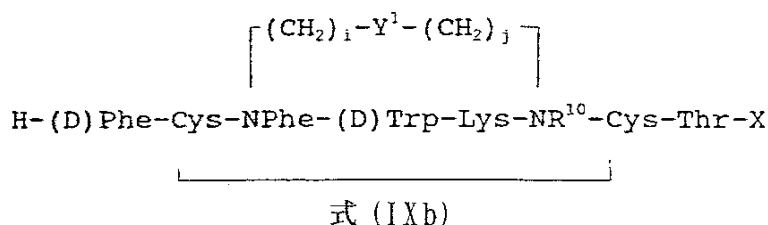
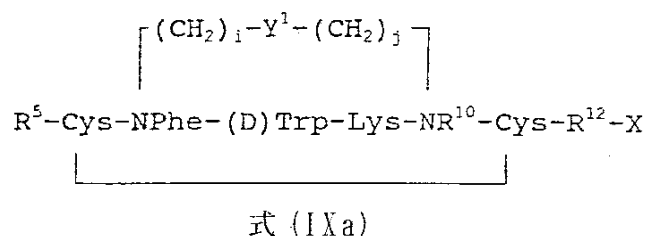
一般式 VIII (a, b) および IX (a, b)：



式 (VIIIa)

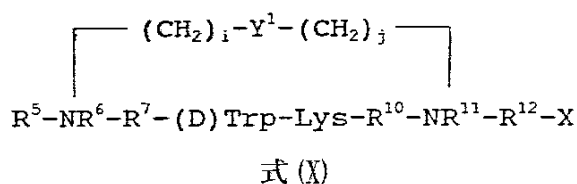


式 (VIIIb)



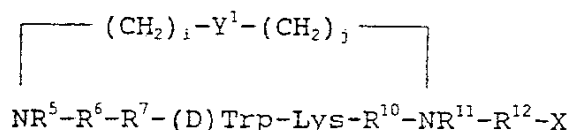
[上記各式中、 i および j は独立に 1 ～ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまたはカルボキシ末端アルコールを表し； R^5 は存在しないか、(D)-もしくは (L)-Phe、Nal、または β -Asp(Ind) であり； R^{10} は存在しないか、Gly、Abu、または Thr であり； R^{12} は存在しないか、Thr または Nal であり； Y^1 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]；

一般式 (X)：



[式中、 i および j は独立に 1 ～ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまたはカルボキシ末端アルコールを表し； R^5 は (D)-Phe もしくは 2-Nal であり； R^6 は Phe、Gly または Ala であり； R^7 は Tyr または pClPhe であり； R^{10} は Thr、Val、Ser または Abu であり； R^{11} は Phe、Gly または Ala であり； R^{12} は Thr、Val、2-Nal または (D)-2-Nal であり； Y^1 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]；

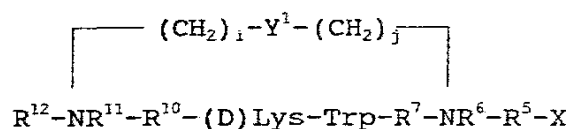
一般式 (XI)：



式 (XI)

[式中、 i および j は独立に 1 ~ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまたはカルボキシ末端アルコールを表し； R^5 は (D)-Phe もしくは (L)-Phe、Ala または Lys であり； R^6 は存在しないかまたは Phe であり； R^7 は Tyr または Phe であり； R^{10} は存在しないかまたは Thr、Val、Ser または Abu であり； R^{11} は Phe、Gly または Ala であり； R^{12} は Trp、Thr、Val、2-Nal または (D)-2-Nal であり； Y^1 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]；

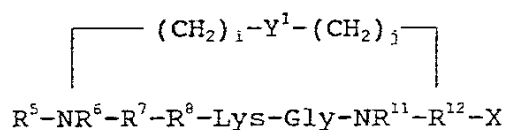
一般式 (XII)：



式 (XII)

[式中、 i および j は独立に 1 ~ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまたはカルボキシ末端アルコールを表し； R^5 は Phe、(L)-2-Nal もしくは (D)-2-Nal であり； R^6 は Phe、Gly または Ala であり； R^7 は (D)-Phe、pCl (D)-Phe、pNH₂Phe または (D)-Tyr であり； R^{10} は (D)-Thr、(D)-Val、(D)-Ala、(D)-Leu または (D)-Glu であり； R^{11} は Phe、Gly または Ala であり； R^{12} は存在しないかまたは Thr もしくは Val であり； Y^1 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]；

一般式 (XIII)：

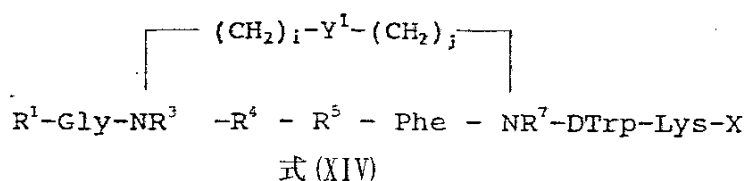


式 (XIII)

[式中、 i および j は独立に 1 ~ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまた

はカルボキシ末端アルコールを表し； R^5 は存在しないかまたは(D)-Phe もしくは 2-Nal であり； R^6 は Phe、Gly または Ala であり； R^7 は(D)-Phe、pCl(D)-Phe、 pNH_2 Phe または(D)-Tyr であり； R^8 は(D)もしくは(L)-Trp であり； R^{11} は Phe、Gly または Ala であり； R^{12} は Thr、Val、Ala、 β -Ala、(L)-2-Nal または(D)-2-Nal であり； Y^1 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]；

一般式 (XIV)：



[式中、 i および j は独立に 1 ～ 5 であり； X はカルボキシ末端アミドまたはカルボキシ末端アルコールを表し； R^1 は Ala または(D)-2-Nal であり； R^3 は Phe、Gly、Ala または Lys であり； R^4 は Lys または Arg であり； R^5 は(L)-Asn または(D)-Asn であり； R^7 は Phe、Gly、Ala または Lys であり； Y^1 はアミド、チオエーテル、チオエステルおよびジスルフィドよりなる群から選ばれる]

のいずれか 1 つで表される、請求項 1 または 2 に記載の主鎖環化ソマトスタチン類似体。

4. 構造：

シクロ [NPhe-Tyr-(D) Trp-Lys-Val-NPhe]-Thr-X

(式中、 X はカルボキシ末端酸、カルボキシ末端アミド、カルボキシ末端エステルまたはカルボキシ末端アルコールを表す)；または

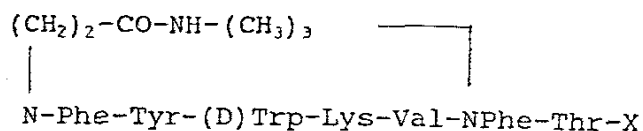
構造：

シクロ [NPhe-Phe-(D) Trp-Lys-Thr-NPhe]-Val-X

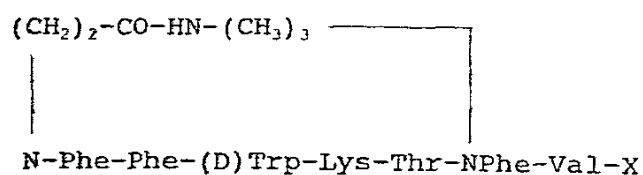
(式中、 X はカルボキシ末端酸、カルボキシ末端アミド、カルボキシ末端

エステルまたはカルボキシ末端アルコールを表す) ;
を有する、請求項 3 に記載の主鎖環化ソマトスタチン類似体。

5. 構造 :



(式中、X はカルボキシ末端酸、カルボキシ末端アミド、カルボキシ末端エステルまたはカルボキシ末端アルコールを表す) ; または
構造 :



(式中、X はカルボキシ末端酸、カルボキシ末端アミド、カルボキシ末端エステルまたはカルボキシ末端アルコールを表す) ;
を有する、請求項 3 に記載の主鎖環化ソマトスタチン類似体。

6. 請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載のソマトスタチン類似体および製剤学的に許容される担体または希釈剤を含んでなる医薬組成物。

7. 内分泌障害、新生物または代謝異常を治療するための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載のソマトスタチン類似体の使用。