

【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】令和6年8月22日(2024.8.22)

【国際公開番号】WO2023/106356

【出願番号】特願2023-566352(P2023-566352)

【国際特許分類】

C 0 7 K 1/06(2006.01)

C 0 7 C 43/23(2006.01)

C 0 7 C 69/712(2006.01)

C 0 7 C 235/06(2006.01)

C 0 7 C 271/16(2006.01)

10

【F I】

C 0 7 K 1/06

C 0 7 C 43/23 C C S P

C 0 7 C 69/712 Z

C 0 7 C 235/06

C 0 7 C 271/16

【手続補正書】

20

【提出日】令和6年6月20日(2024.6.20)

【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】

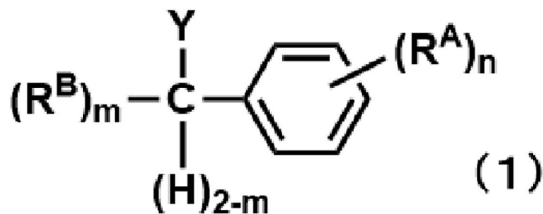
【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(1)で表される置換ベンジル化合物を用いる工程を含む、ペプチド化合物の製造方法。

30

【化1】



式(1)中、Yは、-OH、-NHR、-SH、又は、-Xを表し、Rは、水素原子、アルキル基、アリーラルキル基、ヘテロアリーラルキル基又は9-フルオレニルメトキシカルボニル基を表し、XはCl、Br又はIを表し、mは1又は2を表し、nは1~5の整数を表し、

40

R<sup>B</sup>はそれぞれ独立に、脂肪族炭化水素基を表し、

R<sup>A</sup>はそれぞれ独立に、脂肪族炭化水素基、又は脂肪族炭化水素基を有する有機基であり、少なくとも1つの前記脂肪族炭化水素基の炭素数が12以上であり、式(1)におけるベンゼン環はR<sup>A</sup>に加えて更に置換基を有していてもよい。

【請求項2】

式(1)で表される置換ベンジル化合物を用いる工程が、式(1)で表される置換ベンジル化合物によりアミノ酸化合物又はペプチド化合物のカルボキシ基またはアミド基を保護

50

する C 末端保護工程である、請求項 1 に記載のペプチド化合物の製造方法。

【請求項 3】

C 末端保護工程におけるアミノ酸化合物又はペプチド化合物が、N 末端保護アミノ酸化合物、又は、N 末端保護ペプチド化合物である、請求項 2 に記載のペプチド化合物の製造方法。

【請求項 4】

C 末端保護工程で得られた N 末端保護 C 末端保護アミノ酸化合物又は N 末端保護 C 末端保護ペプチド化合物の N 末端を脱保護する N 末端脱保護工程、及び、

N 末端脱保護工程で得られた C 末端保護アミノ酸化合物又は C 末端保護ペプチド化合物の N 末端に、N 末端保護アミノ酸化合物、又は、N 末端保護ペプチド化合物を縮合させるペ

10

プチド鎖伸長工程

を更に含む、請求項 3 に記載のペプチド化合物の製造方法。

【請求項 5】

ペプチド鎖伸長工程で得られた N 末端保護 C 末端保護ペプチド化合物を沈殿させる沈殿工程を更に含む、請求項 4 に記載のペプチド化合物の製造方法。

【請求項 6】

沈殿工程の後に、

得られた N 末端保護 C 末端保護ペプチド化合物の N 末端を脱保護する工程、

得られた C 末端保護ペプチド化合物の N 末端に、N 末端保護アミノ酸化合物、又は、N 末端保護ペプチド化合物を縮合させる工程、及び、

20

得られた N 末端保護 C 末端保護ペプチド化合物を沈殿する工程

をこの順で 1 回以上更に含む、請求項 5 に記載のペプチド化合物の製造方法。

【請求項 7】

C 末端保護基を脱保護する C 末端脱保護工程を更に含む、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載のペプチド化合物の製造方法。

【請求項 8】

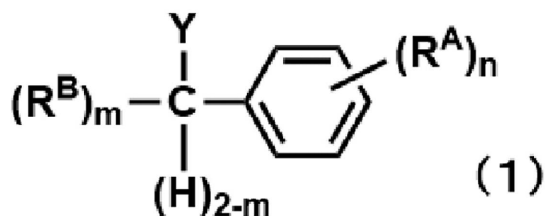
全ての R<sup>A</sup> が有する全ての脂肪族炭化水素基の合計炭素数が、36 ~ 80 である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載のペプチド化合物の製造方法。

【請求項 9】

下記式 (1) で表される置換ベンジル化合物を含む保護基形成用試薬。

30

【化 2】



式 (1) 中、Y は、-OH、-NHR、-SH、又は、-X を表し、R は、水素原子、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基又は 9-フルオレニルメトキシカルボニル基を表し、X は Cl、Br 又は I を表し、m は 1 又は 2 を表し、n は 1 ~ 5 の整数を表し、

40

R<sup>B</sup> はそれぞれ独立に、脂肪族炭化水素基を表し

R<sup>A</sup> はそれぞれ独立に、脂肪族炭化水素基、又は脂肪族炭化水素基を有する有機基であり、少なくとも 1 つの前記脂肪族炭化水素基の炭素数が 12 以上であり、式 (1) におけるベンゼン環は R<sup>A</sup> に加えて更に置換基を有していてもよい。

【請求項 10】

カルボキシ基又はアミド基の保護基形成用試薬である、請求項 9 に記載の保護基形成用試薬。

50

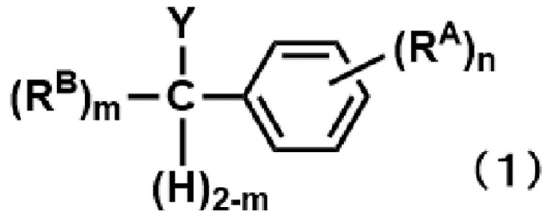
## 【請求項 1 1】

アミノ酸化合物又はペプチド化合物の C 末端保護基形成用試薬である、請求項 9 又は 1 0 に記載の保護基形成用試薬。

## 【請求項 1 2】

下記式 ( 1 ) で表される置換ベンジル化合物。

## 【化 3】



10

式 ( 1 ) 中、Y は、- OH、- NHR、- SH、又は、- X を表し、R は、水素原子、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基又は 9 - フルオレニルメトキシカルボニル基を表し、X は Cl、Br 又は I を表し、m は 1 又は 2 を表し、n は 1 ~ 5 の整数を表し、

R<sup>B</sup> はそれぞれ独立に、脂肪族炭化水素基を表し、

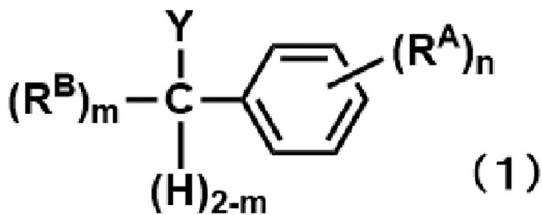
R<sup>A</sup> はそれぞれ独立に、脂肪族炭化水素基、又は脂肪族炭化水素基を有する有機基であり、少なくとも 1 つの前記脂肪族炭化水素基の炭素数が 1 2 以上であり、式 ( 1 ) におけるベンゼン環は R<sup>A</sup> に加えて更に置換基を有していてもよい。

20

## 【請求項 1 3】

下記式 ( 1 ) で表される置換ベンジル化合物を用いる工程を含む、ペプチド化合物の製造方法。

## 【化 4】



30

式 ( 1 ) 中、Y は、- OH、- NHR、- SH、又は、- X を表し、R は、水素原子、アルキル基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基又は 9 - フルオレニルメトキシカルボニル基を表し、X は Cl、Br 又は I を表し、m は 1 又は 2 を表し、n は 1 ~ 5 の整数を表し、

R<sup>B</sup> はそれぞれ独立に、芳香族基 ( フェニル基を除く ) を表し、

R<sup>A</sup> はそれぞれ独立に、脂肪族炭化水素基、又は脂肪族炭化水素基を有する有機基であり、少なくとも 1 つの前記脂肪族炭化水素基の炭素数が 1 2 以上であり、式 ( 1 ) におけるベンゼン環は R<sup>A</sup> に加えて更に置換基を有していてもよい。

40

## 【請求項 1 4】

R<sup>B</sup> は、ナフタレン基を表す、請求項 1 3 に記載のペプチド化合物の製造方法。

50