(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2007 年10 月11 日 (11.10.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/114454 A1

(51) 国際特許分類:
C07K 1/113 (2006.01) *C07K 1/04* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2007/057508

(22) 国際出願日: 2007 年3 月28 日 (28.03.2007)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2006-092569 2006 年3 月29 日 (29.03.2006) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大塚化学株式会社 (OTSUKA CHEMICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5400021 大阪府大阪市中央区大手通３丁目２番２７号 Osaka (JP). 公立大学法人横浜市立大学 (YOKOHAMA CITY UNIVERSITY) [JP/JP]; 〒2360027 神奈川県横浜市金沢区瀬戸２２－２ Kanagawa (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 梶原 康宏 (KAJIHARA, Yasuhiro) [JP/JP]; 〒2360027 神奈川県横浜市金沢区瀬戸２２－２ 公立大学法人横浜市立大学内 Kanagawa (JP). 山本 直毅 (YAMAMOTO, Naoki) [JP/JP]; 〒7710193 徳島県徳島市川内町加賀須野４６３ 大塚化学株式会社内 Tokushima (JP). 南部 由利 (NAMBU, Yuri) [JP/JP]; 〒7710193 徳島県徳島市川内町加賀須野４６３ 大塚化学株式会社内 Tokushima (JP). 深江 一博 (FUKAE, Kazuhiro) [JP/JP]; 〒7710193 徳島県徳島市川内町加賀須野４６３ 大塚化学株式会社内 Tokushima (JP). 朝井 洋明 (ASAI, Hiroaki) [JP/JP]; 〒7710193 徳島県徳島市川内町加賀須野４６３ 大塚化学株式会社内 Tokushima (JP).

(74) 代理人: 田村 巌 (TAMURA, Iwao); 〒5610872 大阪府豊中市寺内１丁目９番２２号 Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

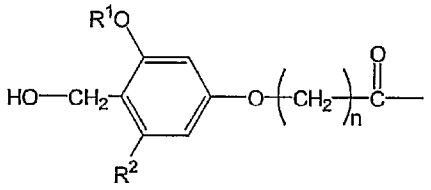
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: METHOD FOR PRODUCTION OF PEPTIDE THIOESTER COMPOUND

(54) 発明の名称: ペプチドのチオエステル化合物の製造方法



(1)

(57) Abstract: Disclosed is a method for production of a peptide thioester compound, which comprises the following steps (A) to (C): (A) forming a peptide by a solid phase synthesis method using a resin modified with a linker represented by the formula (1) as a solid phase; (B) cleaving the bond between the solid phase and the peptide with at least one acid selected from dilute hydrochloric acid, dilute sulfuric acid and acetic acid to produce a peptide having a carboxyl group at the C-terminus; and (C) reacting the resulting peptide with a thiol compound in a solvent in the presence of a condensing agent at -100 to 0° to produce the peptide thioester compound. (1) wherein R^1 represents a C_{1-4} alkyl group; R^2 represents a hydrogen atom or a C_{1-4} alkoxy group; and n represents an integer of 1 to 4.

(57) 要約: (A)式(1)で表されるリンカーで修飾された樹脂を固相として使用し、固相合成法でペプチドを形成させ、(B)希塩酸、希硫酸、蟻酸、及び酢酸から選ばれる少なくとも1種の酸で固相とペプチドとの結合を切断して、C末端にカルボキシル基を有するペプチドを製造し、(C)溶媒中、縮合剤の存在下、チオール化合物を-100～0℃で反応させることを特徴とするペプチドのチオエステル化合物の製造方法。(1)[式中、R^1はC_{1-4}アルキル基を示し、R^2は水素原子、C_{1-4}アルコキシ基を示す。nは1～4の整数を示す。]

WO 2007/114454 A1