(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
2009 年2 月5 日 (05.02.2009)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2009/017154 A1

(51) 国際特許分類:
C07K 1/113 (2006.01) *C08B 37/00* (2006.01)
C07K 5/10 (2006.01) *C07K 9/00* (2006.01)
C07K 7/06 (2006.01) *C07K 14/46* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2008/063659

(22) 国際出願日: 2008 年7 月30 日 (30.07.2008)

(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2007-199372 2007 年7 月31 日 (31.07.2007) 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り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]; 〒2340027 神奈川県横浜市金沢区瀬戸２２番２号 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]; 〒2340027 神奈川県横浜市金沢区瀬戸２２番２号 公立大学法人横浜市立大学内 Kanagawa (JP). 坂本 泉 (SAKAMOTO, Izumi) [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: 南条 雅裕 (NANJO, Masahiro); 〒1066123 東京都港区六本木６－１０－１ 六本木ヒルズ森タワー２３階 ＴＭＩ総合法律事務所 Tokyo (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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, 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, ME, 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, ST, 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, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, 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
— 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部分、請求に基づき国際事務局から入手可能

(54) **Title:** METHOD FOR PRODUCING PEPTIDE

(54) 発明の名称: ペプチドの製造方法

(57) **Abstract:** It is intended to provide a method for producing a peptide characterized by, in a peptide containing an amino acid residue having an -SH group, converting the -SH group into an -OH group, and including the following steps (a) to (c): (a) a step of converting an -SH group in a peptide into an -SMe group by reacting the -SH group with a methylating agent; (b) a step of forming a reaction intermediate by reacting the -SMe group obtained in the step (a) with a cyanide agent; and (c) a step of converting the reaction intermediate obtained in the step (b) into a peptide containing an amino acid residue having an -OH group under a more basic condition compared with the step (b).

(57) 要約: 本発明は、-SH基を有するアミノ酸残基を含むペプチドにおいて、前記-SH基を-OH基に変換することを特徴とするペプチドの製造方法であって、以下の工程(a)～(c)： (a)ペプチド中の-SH基とメチル化剤とを反応させることにより、前記-SH基を-SMe基に変換する工程；(b)工程(a)で得られた-SMe基とシアン化剤とを反応させることにより、反応中間体を生成する工程；及び(c)工程(b)と比較して塩基性条件下、工程(b)で得られた反応中間体を、-OH基を有するアミノ酸残基を含むペプチドに変換する工程；を含む、前記製造方法を提供する。

WO 2009/017154 A1