

【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3年9月30日(2021.9.30)

【公表番号】特表2020-532534(P2020-532534A)

【公表日】令和2年11月12日(2020.11.12)

【年通号数】公開・登録公報2020-046

【出願番号】特願2020-512441(P2020-512441)

【国際特許分類】

C 0 7 K	7/06	(2006.01)
C 0 7 K	7/08	(2006.01)
C 0 7 K	14/00	(2006.01)
A 6 1 K	39/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/54	(2017.01)
A 6 1 K	39/39	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/16	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
C 0 7 C	323/60	(2006.01)

【F I】

C 0 7 K	7/06	Z N A
C 0 7 K	7/08	
C 0 7 K	14/00	
A 6 1 K	39/00	H
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	47/54	
A 6 1 K	39/39	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	31/06	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	31/16	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	31/12	
C 0 7 C	323/60	C S P

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月17日(2021.8.17)

【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

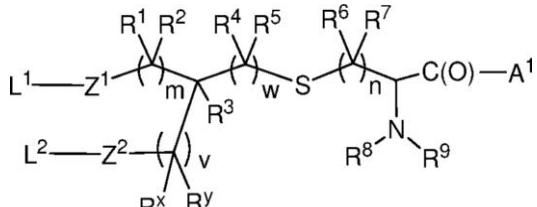
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式(I)の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくは溶媒和物であって：

【化1】



(I)

(式中、

m 及び w は、それぞれ独立して、0 ~ 7 の整数であり、v は、0 ~ 5 の整数であり、(ただし：

m、v、及びwの合計は、少なくとも3であり；

m 及び w の合計は、0 ~ 7 である)；

n は、1 または 2 であり；

Z1 及び Z2 は、それぞれ独立して、-O-、-NR-、-S-、-S(O)-、-SO2-、-C(O)O-、-OC(O)-、-C(O)NR-、-NRC(O)-、-C(O)S-、-SC(O)-、-OC(O)O-、-NRC(O)O-、-OC(O)NR-、及び -NRC(O)NR- からなる群から選択され；

R1、R2、Rx、Ry、R4、R5、R6、及び R7 は、m、v、w、及び n の各場合において、それぞれ独立して、水素または C1 ~ 6 脂肪族であり；

R、R3、及び R8 は、それぞれ独立して、水素または C1 ~ 6 脂肪族であり；

R9 は、水素、C1 ~ 6 脂肪族、アミノ保護基、L3-C(O)-、または A2 であり；

L1 及び L2 は、それぞれ独立して、C5 ~ 21 脂肪族または C4 ~ 20 ヘテロ脂肪族から選択され；

L3 は、C1 ~ 21 脂肪族または C2 ~ 20 ヘテロ脂肪族であり；

A1 は、アミノ酸、ペプチド、OH、OP1、NH2、または NHP2 であり(ここで、P1 は、カルボキシル保護基であり、P2 は、カルボキサミド保護基である)；

A2 は、アミノ酸またはペプチドであり；

ここで、R、R1、R2、R3、R4、R5、R6、R7、R8、R9、Rx、Ry、L1、L2、及び L3 のいずれかに存在する任意の脂肪族またはヘテロ脂肪族が、任意選択で置換される)；

ただし：

(1) R9 及び A1 の少なくとも 1 つは、下記のものからなる群れから選択される 1 アミノ酸配列：

(a) Xaa₁ は不在であるか、S であり、Xaa₂ は不在であるか、親水性アミノ酸であり、Xaa₃ は不在であるか、親水性アミノ酸であり、Xaa₄ は不在であるか、1 つ以上の親水性アミノ酸である、配列 Xaa₁Xaa₂Xaa₃Xaa₄LQQQLSLLMWITQXaa₂₂FLPVFLAQPPSGQR [配列番号：1] からの 8 個以上の連続するアミノ酸残基、

(b) Xaa₁ は不在であるか、S であり、Xaa₂ は不在であるか、親水性アミノ酸であり、Xaa₃ は不在であるか、1 ~ 10 個の親水性アミノ酸である、配列 Xaa₁Xaa₂Xaa₃LQQQLSLLMWITQXaa₂₂FLPVFLAQPPSGQR [配列番号：2] からの 8 個以上の連続するアミノ酸残基、

(c) Xaa₁ は不在であるか、S であり、及び Xaa₂ は不在であるか、1 ~ 4 個の親水性アミノ酸である、配列 Xaa₁Xaa₂LQQQLSLLMWITQXaa₂₂FLPVFLAQPPSGQR [配列番号：3] からの 8 個以上の連続するアミノ酸残基、

(d) 配列 S K K K K L Q Q L S L L M W I T Q X a a₂₂ F L P V F L A Q P P S G Q R R [配列番号：4] からの 8 個以上の連続するアミノ酸残基、

(e) 配列番号：1 ~ 4 のいずれか 1 つの配列、

(f) 配列 L Q Q L S L L M W I T Q X a a₂₂ F L P V F L A Q P P S G Q R R [配列番号：5] からの 8 個以上の連続するアミノ酸残基、

(g) 配列番号：5 の配列、

(h) 配列 S L L M W I T Q X a a₂₂ F L P V F [配列番号：6] からの 8 個以上の連続するアミノ酸残基、

(i) 配列番号：6 の配列、

(j) 配列 S K K K K S L L M W I T Q X a a₂₂ [配列番号：7] からの 8 個以上の連続するアミノ酸残基、

(k) 配列番号：7 の配列、

(l) 配列 S L L M W I T Q X a a₂₂ [配列番号：8] からの 8 個以上の連続するアミノ酸残基、

(m) 配列番号：8 の配列、

(n) または前記 (a) ~ (m) のうちの 2 つ以上の任意の組合せ、

(ここで、それぞれの配列中の X a a₂₂ は、独立して、C を除く任意の天然に存在するアミノ酸（例えば、V、I、または L）であり、前記配列のいずれかからの 8 個以上の連続するアミノ酸残基の任意の配列が、X a a₂₂ を含む）；

を含むか、実質的にそれらからなるか、それらからなるペプチドであり；もしくは

(2) m は、3 ~ 7 の整数であり、R 9 及び A 1 の少なくとも 1 つはアミノ酸またはペプチドである、

ことを条件とする、

化合物。

【請求項 2】

R 9 及び A 1 の少なくとも 1 つが、請求項 1 の条件 (1) に規定されるとおりの群れから選択される 1 つ以上のアミノ酸配列を含むか、実質的にそれらからなるか、それらからなるペプチドである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

m が、3 ~ 7 の整数であり、R 9 及び A 1 の少なくとも 1 つは、請求項 1 の条件 (2) に規定されるとおりのアミノ酸またはペプチドである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R 9 及び A 1 の少なくとも 1 つが、ペプチドであり、ペプチドが、配列番号 8 ~ 1 2 9 のいずれか 1 つのアミノ酸配列の 8 個以上の連続するアミノ酸からなる群から選択されるアミノ酸配列を含むか、実質的にそれらからなるか、それらからなるか、あるいは、ペプチドが、請求項 1 の条件 (1) に規定される群れから選択される 1 つ以上のアミノ酸配列を含むか、実質的にそれらからなるか、それらからなる、請求項 3 に記載の化合物。

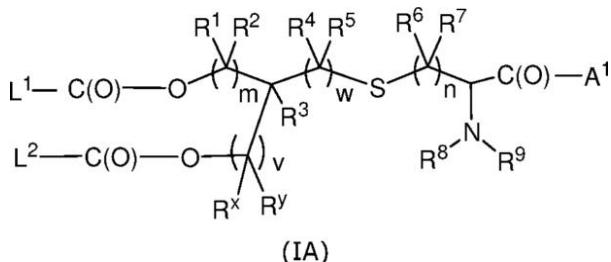
【請求項 5】

Z 1 及び Z 2 が、それぞれ独立して、- C (O) O -、- C (O) N R -、及び - C (O) S - からなる群から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

前記化合物が、下記式 (IA) の化合物である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物：

【化2】



【請求項7】

wが、1または2であり、そして／あるいは、nが、1であり、そして／あるいは、vが、0～3である、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

L1及びL2が、それぞれ独立して、C5～21アルキル、好ましくは線状C15アルキルであり、そして／あるいは、L3が、メチルまたは線状C15アルキル、好ましくはメチルである、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

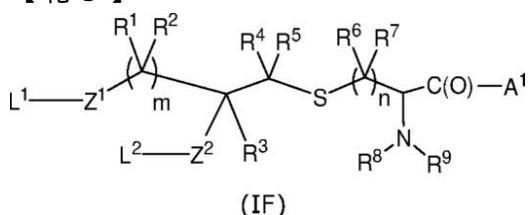
【請求項9】

R1及びR2が、mの各場合において、それぞれ独立して、C1～6アルキルまたは水素、好ましくは水素であり、そして／あるいは、R3が、C1～6アルキルまたは水素、好ましくは水素であり、そして／あるいは、R4及びR5が、wの各場合において、それぞれ独立して、C1～6アルキルまたは水素、好ましくは水素であり、そして／あるいは、R_x及びR_yが、vの各場合において、それぞれ独立して、C1～6アルキルまたは水素、好ましくは水素であり、そして／あるいは、R6及びR7が、nの各場合において、それぞれ独立して、C1～6アルキルまたは水素、好ましくは水素であり、そして／あるいは、R8が、独立して、C1～6アルキルまたは水素、好ましくは水素であり、そして／あるいは、R9が、C1～6アルキル、水素、アミノ保護基、L3-C(O)、またはA2、好ましくは水素、アミノ保護基、L3-C(O)、またはA2である、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

化合物が、下記式(I F)の化合物：

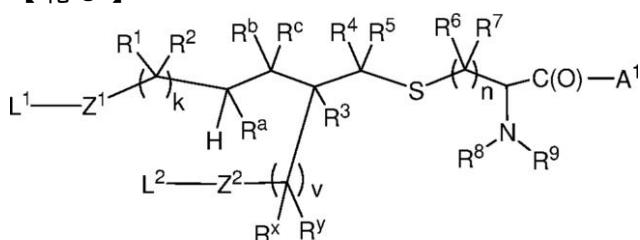
【化3】



または

下記式(I B)の化合物：

【化5】



(式中、

kは、0～4の整数、好ましくは0～3であり；

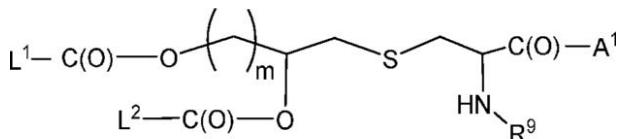
R^a、R^b、及びR^cは、それぞれ独立して、水素またはC1～6脂肪族、好ましく

は水素またはC 1 ~ 6 アルキル、好ましくは水素である)である、請求項1~9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項11】

化合物は、下記式(ID-1)の化合物である、請求項1~10のいずれか一項に記載の化合物：

【化7】

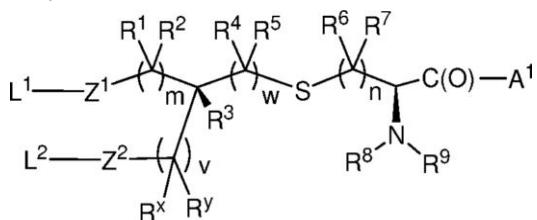


(ID-1)

【請求項12】

前記化合物は、下記式(IE-1)：

【化10】

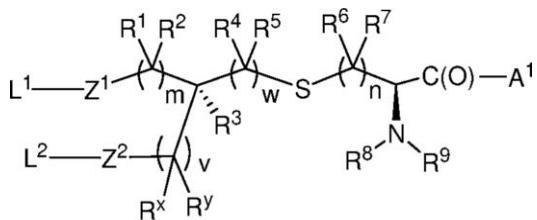


(IE-1)

を有するか、あるいは

下記式(IE-2)：

【化11】



(IE-2)

を有する、請求項1~11のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

脂質部分が接合されているペプチド接合体のアミノ酸が、N-末端アミノ酸残基であり、そして/あるいは、A1が、セリンまたは第1のN-末端アミノ酸残基としてセリンを含むペプチドである、請求項1~12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項14】

有効量の請求項1~13のいずれか一項に記載のペプチド接合体化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくは溶媒和物、及び薬学的に許容可能な担体を含む、薬学的組成物。

【請求項15】

対象にワクチンを接種するか免疫応答を誘発するか、あるいはTLR2を活性化する方法における使用のための、請求項1~13のいずれか一項に記載の1つ以上のペプチド接合体化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくは溶媒和物、または請求項14に記載の薬学的組成物。

【請求項16】

対象にワクチンを接種するか免疫応答を誘発するか、あるいはTLR2を活性化するための薬学的組成物の製造における、請求項1~13のいずれか一項に記載の1つ以上のペプチド接合体化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくは溶媒和物の使用。