

【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 2 年 4 月 9 日 (2020.4.9)

【公表番号】特表 2019-509280 (P2019-509280A)

【公表日】平成 31 年 4 月 4 日 (2019.4.4)

【年通号数】公開・登録公報 2019-013

【出願番号】特願 2018-544904 (P2018-544904)

【国際特許分類】

C 0 7 K 14/00 (2006.01)

C 0 7 K 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 K 39/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 K 14/00 Z N A

C 0 7 K 7/00

A 6 1 P 37/04

A 6 1 K 39/00 H

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 2 月 21 日 (2020.2.21)

【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

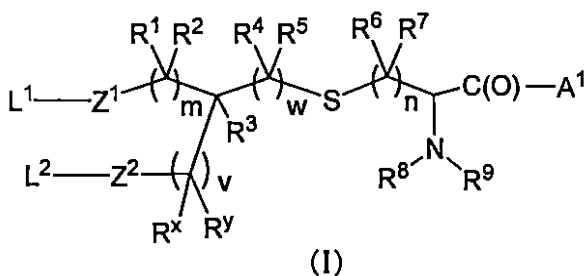
【補正の内容】

【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または溶媒和物：

【化 1】



前記式において、

m および 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、および w の合計は、少なくとも 3 であり；

m および w の合計は、0 ~ 7 であり；

n は、1 または 2 であり；

Z 1 および Z 2 は、それぞれ独立して、- O -、- NR -、- S -、- S ( O ) -、- S O<sub>2</sub> -、- C ( O ) O -、- O C ( O ) -、- C ( O ) NR -、- NR C ( O ) -、- C ( O ) S -、- S C ( O ) -、- O C ( O ) O -、- NR C ( O ) O -、- O C ( O ) NR -、および NR C ( O ) NR - からなる群から選択され；

R 1、R 2、R x、R y、R 4、R 5、R 6、および R 7 は、m、v、w、および n の

各場合に、それぞれ独立して、水素 C 1 ~ 6 脂肪族であり、

R、R 3、および R 8 は、それぞれ独立して、水素または C 1 ~ 6 脂肪族であり；

R 9 は、水素、C 1 ~ 6 脂肪族、アミノ保護基、L 3 - C ( O ) - 、または A 2 であり；

L 1 および L 2 は、それぞれ独立して、C 5 ~ 21 脂肪族または C 4 ~ 20 ヘテロ脂肪族から選択され；

L 3 は、C 1 ~ 21 脂肪族または C 2 ~ 20 ヘテロ脂肪族であり；

A 1 は、アミノ酸、ペプチド、OH、OP 1、NH<sub>2</sub>、または NH P 2 であり、ここで、P 1 は、カルボキシル保護基であり、P 2 は、カルボキサミド保護基であり；

A 2 は、アミノ酸またはペプチドであり；

ここで、R、R 1、R 2、R 3、R 4、R 5、R 6、R 7、R 8、R 9、R x、R y、L 1、L 2、および L 3 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は、選択的に置換される。

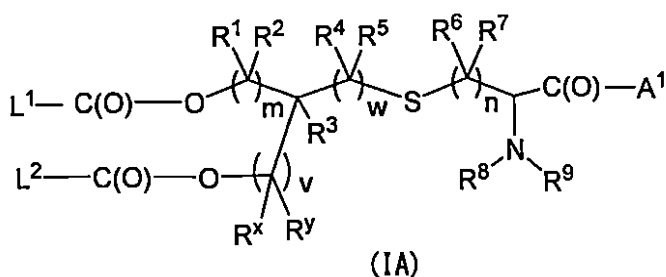
【請求項 2】

Z 1 および Z 2 は、それぞれ独立して、- C ( O ) O - 、- C ( O ) N R - 、および C ( O ) S - からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

前記化合物は、下記式 ( I A ) の化合物である、請求項 1 または 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 2】



【請求項 4】

m および w は、それぞれ独立して、0 ~ 5 であり、および / または m と w との合計は 2 ~ 7 である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

m は 1 ~ 3 であり、および / または w は 1 または 2 であり、および / または n は 1 であり、および / または v は 0 ~ 3 である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

L 1 および L 2 は、それぞれ独立して、C 5 ~ 21 アルキルであり、および / または L 3 は、メチルまたは線状 C 15 アルキルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R 1 および R 2 は、m の各場合に、それぞれ独立して、C 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、および / または R 3 は C 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、および / または R 4 および R 5 は、w の各場合に、それぞれ独立して、C 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、および / または R x および R y は、v の各場合に、それぞれ独立して、C 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、および / または R 6 および R 7 は、n の各場合に、それぞれ独立して、C 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、R 8 は独立して、C 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、および / または R 3 は C 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、R 9 は独立して、C 1 ~ 6 アルキル、水素、アミノ保護基、L 3 - C ( O ) または A 2 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】

【化 3】



下記式 ( I B ) :

【化 4】



の化合物である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

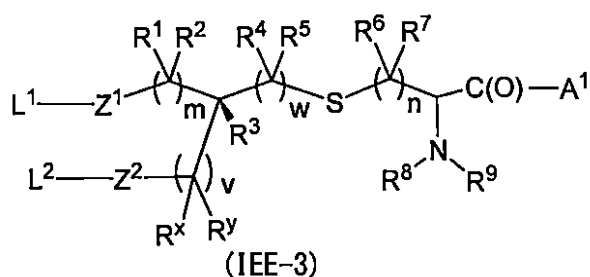
【化 5】



【請求項 10】

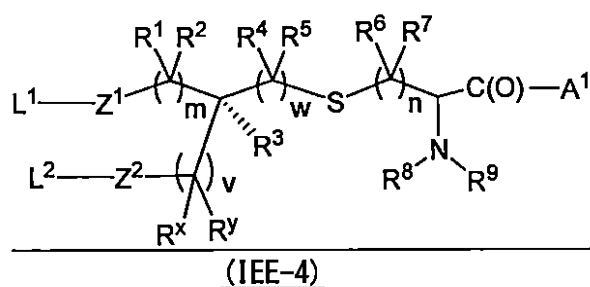
前記式 ( I ) の化合物は、下記式 ( I E E - 3 ) :

【化 6】



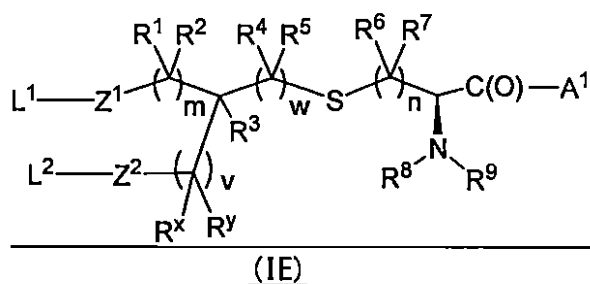
または、下記式 ( I E E - 4 ) :

【化 7】



または、下記式 ( I E ) :

【化 8】



を有する、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 1】

A 1 は、OH、OP 1、NH<sub>2</sub> または NHP 2 であり、R 9 は、水素、C 1 - 6 アルキル、C 3 - 6 シクロアルキル、アミノ保護基、または L 3 - C ( O ) である、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2】

A 1 および / または A 2 は、アミノ酸またはペプチドであり、場合により前記ペプチドはエピトープを含み、場合により前記エピトープはペプチドエピトープである、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 3】

脂質部分が接合されている前記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、および / または A 1 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 ~ 1 0 および 1 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

前記ペプチドは、配列番号 1 ~ 1 2 1 のいずれか 1 つのアミノ酸配列の 8 個以上の連続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、実質的にそれからなるか、ま

たはそれからなる、請求項 1 ~ 1 0、1 2 および 1 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 5】

有効量の請求項 1 ~ 1 4 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または溶媒和物、および薬学的に許容される担体を含む、薬学的組成物。

【請求項 1 6】

対象にワクチンを接種するか免疫応答を誘発する薬剤の製造における、請求項 1 ~ 1 4 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または溶媒和物、または請求項 1 5 に記載の薬学的組成物、の使用。

【請求項 1 7】

対象にワクチンを接種するか免疫応答を誘発するための、請求項 1 ~ 1 4 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または溶媒和物を含む、請求項 1 5 に記載の薬学的組成物。