

【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 07 K 14/00 (2006.01)

C 07 K 7/00 (2006.01)

A 61 P 37/04 (2006.01)

A 61 K 39/00 (2006.01)

【F I】

C 07 K 14/00 Z N A

C 07 K 7/00

A 61 P 37/04

A 61 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

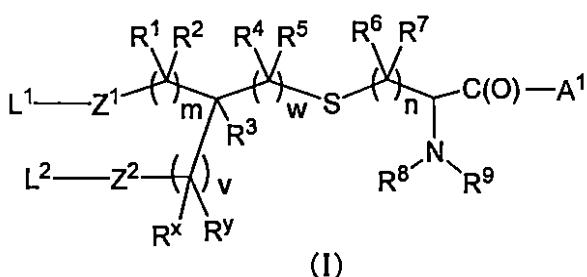
【補正の内容】

【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；

Z1および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-、およびNRC(O)NR-からなる群から選択され；

R1、R2、Rx、Ry、R4、R5、R6、およびR7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、R₃、およびR₈は、それぞれ独立して、水素またはC 1 ~ 6 脂肪族であり；

R₉は、水素、C 1 ~ 6 脂肪族、アミノ保護基、L₃-C(O)-、またはA₂であり；

L₁およびL₂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；

L₃は、C 1 ~ 21 脂肪族またはC 2 ~ 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り；

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、R_x、R_y、L₁、L₂、および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は、選択的に置換される。

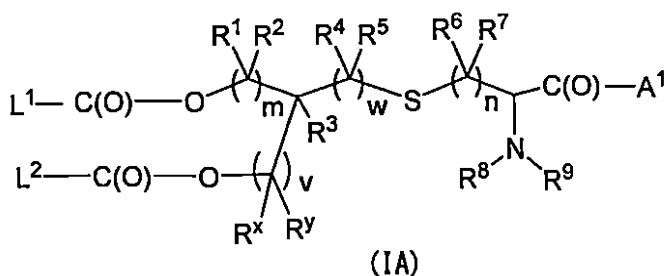
【請求項 2】

Z₁およびZ₂は、それぞれ独立して、-C(O)O-、-C(O)NR-、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(IA)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 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または₃のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

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

【請求項 6】

L₁およびL₂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L₃は、メチルまたは線状C 1 ~ 5 アルキルである、請求項₁または₅のいずれか一項に記載の化合物。

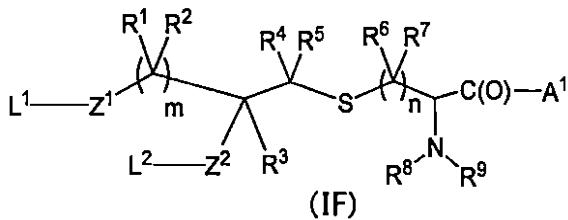
【請求項 7】

R₁およびR₂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R₃はC 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、および/またはR₄およびR₅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R₆およびR₇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、R₈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R₃はC 1 ~ 6 アルキルまたは水素であり、R₉は独立して、C 1 ~ 6 アルキル、水素、アミノ保護基、L₃-C(O)またはA₂である、請求項₁または₆のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

前記化合物は、下記式 (I F) :

【化 3】

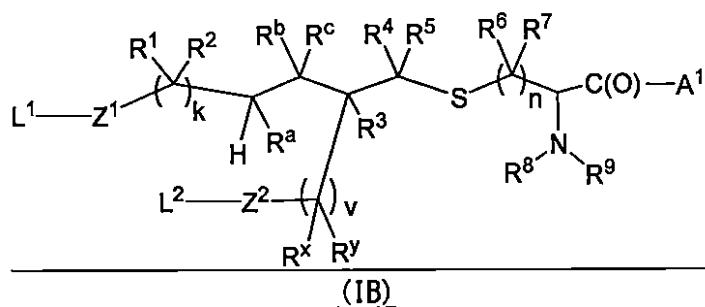


[前記式において、mは、2～6の整数であり、残りの変数は、請求項1～7のいずれか一項に定義される通りである]

の化合物、または

下記式 (I B) :

【化 4】



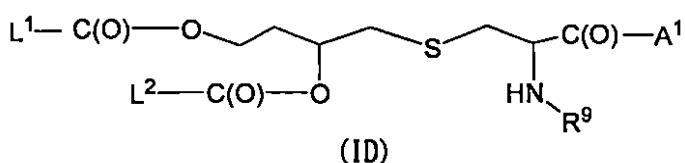
[前記式において、kは、0～4の整数であり、Ra、Rb、およびRcは各々独立して水素原子またはC1～6脂肪族である]

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】

前記化合物は、下記式 (I D) の化合物である、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

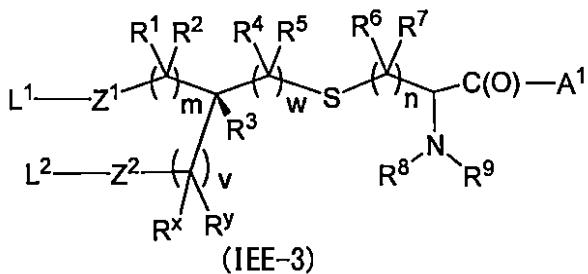
【化 5】



【請求項10】

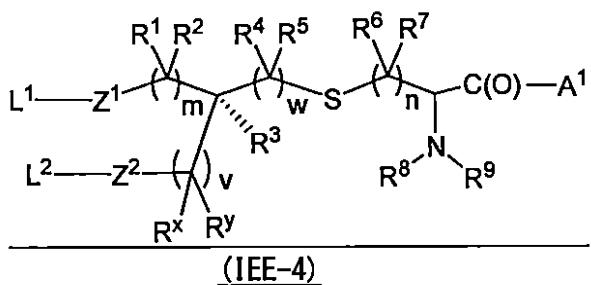
前記式 (I) の化合物は、下記式 (I E E - 3) :

【化6】



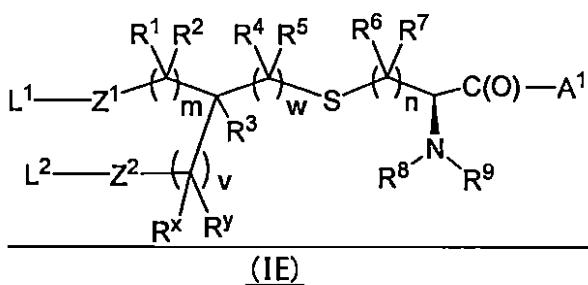
または、下記式 (IEE-4) :

【化7】



または、下記式 (IE) :

【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、O H、O P 1、N H₂ またはN H P 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 ~ 10、12 および 13 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 15】

有効量の請求項 1 ~ 14 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 16】

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 ~ 14 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 15 に記載の薬学的組成物、の使用。

【請求項 17】

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 ~ 14 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 15 に記載の薬学的組成物。