

【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1年11月7日(2019.11.7)

【公表番号】特表2018-529717(P2018-529717A)

【公表日】平成30年10月11日(2018.10.11)

【年通号数】公開・登録公報2018-039

【出願番号】特願2018-516214(P2018-516214)

【国際特許分類】

C 0 7 D 473/18 (2006.01)

A 6 1 K 39/39 (2006.01)

A 6 1 K 39/245 (2006.01)

A 6 1 K 39/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 39/02 (2006.01)

A 6 1 K 39/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/06 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 47/42 (2017.01)

【F I】

C 0 7 D 473/18 C S P

A 6 1 K 39/39

A 6 1 K 39/245

A 6 1 K 39/00 H

A 6 1 P 37/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 39/02

A 6 1 K 39/12

A 6 1 K 47/06

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/42

【手続補正書】

【提出日】令和1年9月27日(2019.9.27)

【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

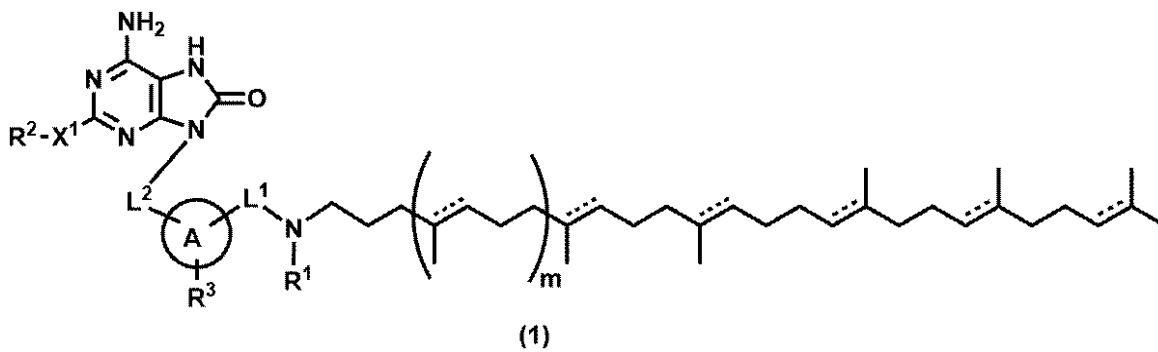
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1) :

【化1】



[式中、

L^1 および L^2 は、独立してアルキレンであり、

R^1 は、水素原子またはアルキルであり、

R^2 は、置換されていてもよいアルキルであり、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子、アルキルまたはアルコキシであり、

X^1 は単結合、酸素原子、硫黄原子、 SO 、 SO_2 、 NR^4 または $CONR^4$ であり、

R^4 は水素原子またはアルキルであり、

A は、単環の芳香族炭素環、または、1～4個の窒素原子、1個の酸素原子および1個の硫黄原子から選択される、1～4個のヘテロ原子を含む5もしくは6員の芳香族ヘテロ環であり、

m は0または1であり、

【化2】

で示される結合は、独立して単結合もしくは二重結合を表す]

で示される、化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

L^1 は、 C_{1-4} アルキレンであり、

L^2 は、 C_{1-4} アルキレンであり、

R^1 は、水素原子または C_{1-4} アルキルであり、

R^2 は、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルであって、該アルキルが置換されている場合には、ヒドロキシ、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、1もしくは2個の同一もしくは異なる C_{1-6} アルキルで置換されていてもよいアミノ、およびカルボキシから選択される同一もしくは異なってもよい1～4個の置換基で置換されており、

R^3 は、水素原子、ハロゲン原子、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシであり、

X^1 は、単結合、酸素原子、硫黄原子、 SO 、 SO_2 、 NR^4 または $CONR^4$ であり、

R^4 は、水素原子または C_{1-4} アルキルである、請求項1記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項3】

R^2 が、ヒドロキシ、ハロゲン原子、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシから選択される、同一もしくは異なる1～3の基で置換されていてもよい C_{1-6} アルキルである、請求項1または2に記載の式(1)で示される化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項4】

A が、ベンゼン環またはピリジン環である、請求項1～3のいずれかに記載の式(1)で示される化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項5】

A がベンゼン環である、請求項4に記載の式(1)で示される化合物またはその薬学上

許容される塩。

【請求項 6】

L^2 がメチレンである、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の式 (1) で示される化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項 7】

R^2 が、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ヒドロキシ-アルキルまたは C_{1-4} アルコキシ- C_{1-4} アルキルである、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の式 (1) で示される化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項 8】

L^1 は、 C_{1-3} アルキレンであり、 R^1 は、水素原子または C_{1-3} アルキルである、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の式 (1) で示される化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項 9】

【化 3】

で示される結合がすべて単結合であるか、または

【化 4】

で示される結合がすべて二重結合である、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の式 (1) で示される化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項 10】

R^1 が水素原子またはメチルである、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の式 (1) で示される化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項 11】

L^1 は、メチレンであり、

L^2 は、メチレンであり、

R^1 は、水素原子またはメチルであり、

R^2 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ- C_{2-4} アルキル、または 1 ~ 4 個のヒドロキシ基で置換された C_{2-6} アルキルであり、ここで 2 以上のヒドロキシ基は異なる炭素原子に結合しており、

R^3 は、水素原子、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシまたはハロゲン原子であり、

、

X^1 は、単結合、酸素原子、 NR^4 または $CONR^4$ であり、

R^4 は、水素原子または C_{1-3} アルキルであり、

A は、ベンゼン環またはピリジン環であり、

【化 5】

で示される結合はすべて単結合であるか、または

【化 6】

で示される結合はすべて二重結合である、

請求項 1 に記載の式 (1) で示される化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項 12】

以下からなる群：

6-アミノ-2-プトキシ-9-[4-({ [(4E, 8E, 12E, 16E, 20E) - 4, 8, 12, 17, 21, 25 - ヘキサメチルヘキサコサ - 4, 8, 12, 16, 20, 24 - ヘキサエン - 1 - イル] (メチル) アミノ } メチル) ベンジル] - 7, 9 - ジヒドロ - 8H - プリン - 8 - オン；

6-アミノ-9-[4-({ [(4E, 8E, 12E, 16E, 20E) - 4, 8, 12, 17, 21, 25 - ヘキサメチルヘキサコサ - 4, 8, 12, 16, 20, 24 - ヘ

キサエン - 1 - イル } (メチル) アミノ } (メチル) ベンジル] - 2 - (2 - メトキシエトキシ) - 7 , 9 - ジヒドロ - 8 H - プリン - 8 - オン ; および
6 - アミノ - 2 - (2 , 3 - ジヒドロキシプロポキシ) - 9 - [[4 - [[[(4 E , 8 E , 1 2 E , 1 6 E , 2 0 E) - 4 , 8 , 1 2 , 1 7 , 2 1 , 2 5 - ヘキサメチルヘキサコサ - 4 , 8 , 1 2 , 1 6 , 2 0 , 2 4 - ヘキサエニル] - メチル - アミノ] メチル] フェニル] メチル] - 7 H - プリン - 8 - オン

から選択される、請求項1に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項13】

請求項1～12のいずれかに記載の式(1)で示される化合物またはその薬学上許容される塩を含む医薬組成物。

【請求項14】

医薬組成物が、油成分としてのスクアレン、Span(登録商標)85(トリオレイン酸ソルビタン)およびポロキサマー188を含んでなる水中油型エマルジョンである、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

医薬組成物が、油成分としてのスクアレン、L- -ホスファチジルコリンおよびポロキサマー188を含んでなる水中油型エマルジョンである、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項16】

水中油型エマルジョンが含んでなる液滴の平均粒径が10～1000nm±10nmである、請求項14または15に記載の医薬組成物。

【請求項17】

更に抗原を含む、請求項13～16のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項18】

抗原が病原体由来抗原または腫瘍抗原である、請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項19】

抗原がペプチドまたはタンパク質である、請求項17または18に記載の医薬組成物。

【請求項20】

請求項1～12のいずれかに記載の化合物またはその薬学上許容される塩を含む、ワクチンアジュバント。

【請求項21】

ワクチンアジュバントとして使用するための、請求項1～12のいずれかに記載の式(1)で示される化合物またはその薬学上許容される塩を含む組成物。

【請求項22】

請求項1～12のいずれかに記載の式(1)で示される化合物またはその薬学上許容される塩を含む、癌の治療または予防剤。

【請求項23】

請求項1～12のいずれかに記載の化合物またはその薬学上許容される塩を含む、抗原の免疫賦活活性の向上剤。

【請求項24】

ワクチンアジュバントの製造のための、請求項1～12のいずれかに記載の化合物またはその薬学上許容される塩の使用。

【請求項25】

請求項1～12のいずれかに記載の化合物またはその薬学上許容される塩を含む、抗原と併用するための、ワクチンアジュバント。

【請求項26】

抗原が病原体由来抗原または腫瘍抗原である、請求項25に記載のワクチンアジュバント。

【請求項27】

抗原がペプチドまたはタンパク質である、請求項25または26に記載のワクチンアジ

ジュバント。

【請求項 28】

抗原が癌免疫療法のための腫瘍抗原タンパク質または腫瘍抗原ペプチドである、請求項 25 ~ 27 のいずれかに記載のワクチンアジュバント。

【請求項 29】

抗原が感染症の治療用または予防用ワクチンの有効成分である、請求項 25 ~ 27 のいずれかに記載のワクチンアジュバント。

【請求項 30】

以下の (a) および (b) を含むキット；

(a) 請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩；および

(b) 抗原。