

【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】平成29年3月9日(2017.3.9)

【公開番号】特開2017-8098(P2017-8098A)

【公開日】平成29年1月12日(2017.1.12)

【年通号数】公開・登録公報2017-002

【出願番号】特願2016-182748(P2016-182748)

【国際特許分類】

C 07 H 15/04 (2006.01)

C 07 H 1/00 (2006.01)

【F I】

C 07 H 15/04 A

C 07 H 1/00

C 07 H 15/04 F

C 07 H 15/04 D

C 07 H 15/04 E

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月2日(2017.2.2)

【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】

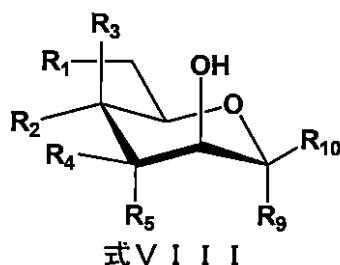
【特許請求の範囲】

【請求項1】

アミノオキシ基を含むリンカーを含むオリゴ糖を製造する方法であって、以下のステップ：

a) 式VIII：

【化1】



【式中、

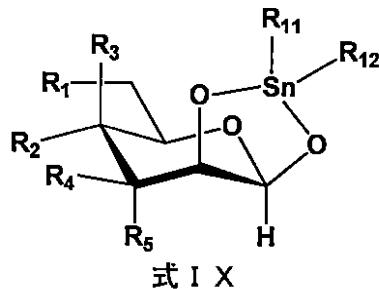
R₁は、水素、ヒドロキシル、任意に置換されたC₁-C₄アルキル、ホスフェート、サルフェート、-OR₇及び保護基から選択され；

R₂、R₃、R₄およびR₅は、それぞれ独立して、水素、サルフェート、ヒドロキシル、-OR₈及び保護基から選択され；

R₇およびR₈は、それぞれ独立して、アセチルおよび任意に置換されたC₁-C₄アルキルから選択され；そして

R₉およびR₁₀は、水素およびヒドロキシルから選択され、ここでR₉およびR₁₀のうちの1つがヒドロキシルのとき、もう一方が水素である】

で表される化合物を、式 $R_{11}R_{12}$ ($S_n = O$) で表される化合物で処理して、式 IX :
【化 2】



〔式中、

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_7 及び R_8 は、上で定義した通りであり、
 R_{11} および R_{12} はそれぞれ独立に、非置換アルキルであり、または R_{11} および R_{12} は一
緒になって、非置換アルキレンである]

で表される化合物を形成し；ならびに、

b) 式 IX の化合物を、任意に金属フッ化物の存在下、式 $R_6 - (CH_2)_n - L$:

〔式中、

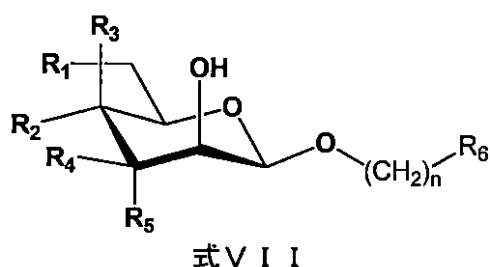
R_6 は、水素、ヒドロキシル、カルボキシル、アルコキシカルボニル、アミノ、アミド
、アルキルアミノ、アミノアルキル、アミノオキシ、ヒドラジド、ヒドラジン、任意に置
換されたアルケニル、および任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキルから選択され；

n は、1 ~ 10 の整数であり；そして

L はハロゲンである]

で表される化合物で処理して式 V II :

【化 3】



〔式中、

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 及び n は、上で定義した通りである
]

で表される化合物を形成し；

c) 式 V II の化合物を、少なくとも 1 つの任意に保護された单糖で処理して、オリゴ
糖を形成し、ここで前記单糖は、

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 のいずれか 1 つに追加され、そして

d) アミノオキシ基を含むリンカーを前記オリゴ糖に結合すること、ここで前記アミノ
キシ基を含むリンカーは R_6 に連結される、
を含む、前記方法。

【請求項 2】

R_6 はアルコキシカルボニルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

nは、2、3、4、5または6である、請求項1または2に記載の方法。

【請求項4】

nは3であり、R₆はメトキシカルボニルである、請求項1に記載の方法。

【請求項5】

式R₆-(CH₂)_n-Lの化合物が、4-プロモ酪酸メチルである、請求項1~4のいずれか1項に記載の方法。

【請求項6】

式VIIIの化合物が、任意に保護されたマンノース、ラムノース、イドース、およびアルトロースから選択される、請求項1~5のいずれか1項に記載の方法。

【請求項7】

式IIIの化合物が、任意に保護されたマンノースである、請求項6に記載の方法。

【請求項8】

前記金属フッ化物が、フッ化セシウム、フッ化ナトリウム、フッ化カルシウム、フッ化マグネシウム、フッ化リチウム、およびフッ化カリウムから選択される、請求項1~7のいずれか1項に記載の方法。

【請求項9】

ステップbが、テトラアルキルアンモニウムハライドの存在下、式IXの化合物を反応させることをさらに含む、請求項1~8のいずれか1項に記載の方法。

【請求項10】

前記テトラアルキルアンモニウムハライドが、テトラブチルアンモニウムヨージドである、請求項9に記載の方法。

【請求項11】

R₁₁およびR₁₂がそれぞれ、ブチルであるか、R₁₁およびR₁₂がそれぞれ、ヘキシルであるか、またはR₁₁およびR₁₂が、一緒になってヘキサメチレンを形成する請求項1~10のいずれか1項に記載の方法。

【請求項12】

式VIIIの化合物が、3,4,6-トリ-O-ベンジル-D-マンノースおよび3-O-アリル-6-O-トリチル-D-マンノースから選択される、請求項1~11のいずれか1項に記載の方法。

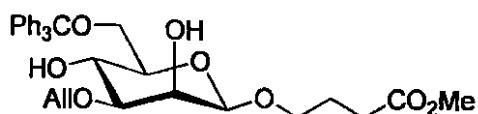
【請求項13】

式VIIIの化合物が、3-O-アリル-6-O-トリチル-D-マンノースである、請求項12に記載の方法。

【請求項14】

式VIIの化合物が、

【化4】



である、請求項13に記載の方法。

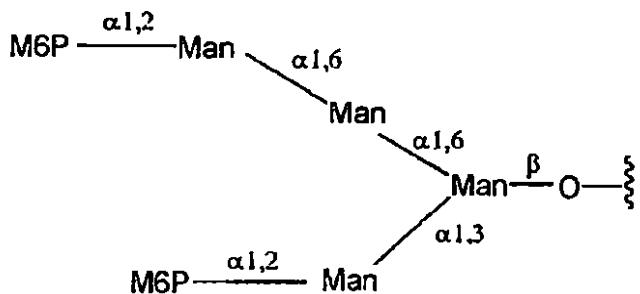
【請求項15】

前記オリゴ糖が六糖である、請求項1~14のいずれか1項に記載の方法。

【請求項16】

前記六糖が、

【化5】



である、請求項15に記載の方法。

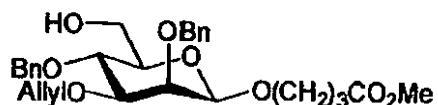
【請求項17】

式VIIの化合物における保護基の位置及び同一性を変化させるステップ、及び／又は追加の保護基を式VIIの化合物へ加えるステップをさらに含む、請求項1～16のいずれか1項に記載の方法。

【請求項18】

請求項17に記載のステップによって得られる化合物が、

【化6】



である、請求項17に記載の方法。