

【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 0 7 H 15/04 (2006.01)

C 0 7 H 1/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 15/04 A

C 0 7 H 1/00

C 0 7 H 15/04 F

C 0 7 H 15/04 D

C 0 7 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】

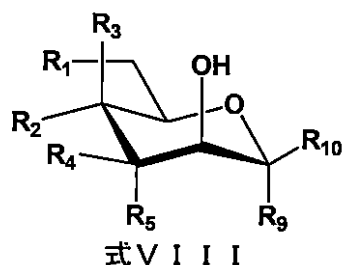
【特許請求の範囲】

【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 V I I I :

【化 1】



[式中、

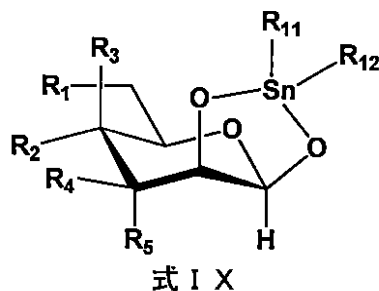
R₁ は、水素、ヒドロキシル、任意に置換された C₁ - C₄ アルキル、ホスフェート、サルフェート、- O R₇ 及び保護基から選択され；

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、- O R₈ 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 $R_{11}R_{12}(Sn=O)$ で表される化合物で処理して、式 I X :
【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 I X 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、

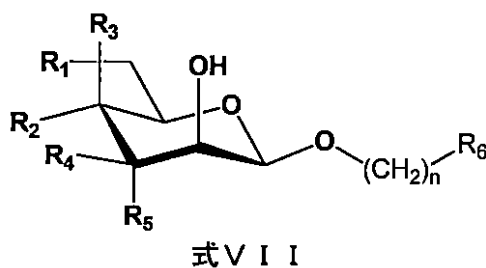
R_6 は、水素、ヒドロキシル、カルボキシル、アルコキシカルボニル、アミノ、アミド、アルキルアミノ、アミノアルキル、アミノオキシ、ヒドラジド、ヒドラジン、任意に置換されたアルケニル、および任意に置換された $C_2 - C_6$ アルキルから選択され；

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 I I :

【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 I I の化合物を、少なくとも 1 つの任意に保護された単糖で処理して、オリゴ糖を形成し、ここで前記単糖は、

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 - ブ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 V I I I 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 I I I 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 I X 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 V I I I 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。

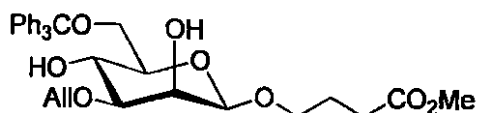
【請求項 13】

式 V I I I 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 V I I の化合物が、

【化 4】



である、請求項 13 に記載の方法。

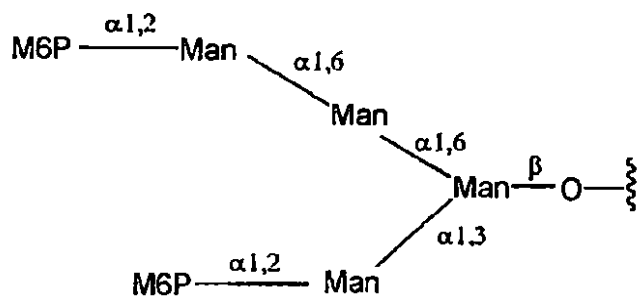
【請求項 15】

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。

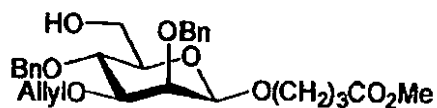
【請求項 17】

式 V I I 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 V I I 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。