

【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 3 区分

【発行日】平成29年6月8日 (2017.6.8)

【公開番号】特開2017-52962(P2017-52962A)

【公開日】平成29年3月16日 (2017.3.16)

【年通号数】公開・登録公報2017-011

【出願番号】特願2016-214773(P2016-214773)

【国際特許分類】

C 0 8 B 37/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 K 14/00 (2006.01)

C 1 2 N 9/14 (2006.01)

【F I】

C 0 8 B 37/00 K

A 6 1 K 37/54

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 43/00 1 0 5

C 0 7 K 14/00

C 1 2 N 9/14

【手続補正書】

【提出日】平成29年4月20日 (2017.4.20)

【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オリゴ糖を調製する方法であって、

(a) 第 1 の反応基を含むオリゴ糖を提供するステップであって、前記第 1 の反応基はヒドラジド基またはカルボキシル基である前記ステップと、

(b) アミノオキシ基および第 2 の反応基を含むアミノオキシ化合物を提供するステップと、

(c) 前記オリゴ糖の前記第 1 の反応基と、前記アミノオキシ化合物の前記第 2 の反応基とを反応させるステップと、

を含み、それによって、前記アミノオキシ基を含むオリゴ糖を調製する方法。

【請求項 2】

前記第 2 の反応基は、ヒドラジン、ヒドラジド、セミカルバジド、チオセミカルバジド、アミン、カルボキシル、エステル、ハロゲン化アシル、アシルアジド、ハロゲン化アルキル、無水物、イソチオシアナート、イソシアナート、およびハロゲン化スルホニル基から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

前記第 1 の反応基は、ヒドラジド基である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

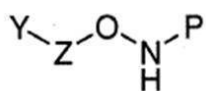
【請求項 4】

前記第 1 の反応基は、カルボキシル基である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 5】

前記アミノオキシ化合物は、化学式 I I の化合物から選択され、

【化 1】



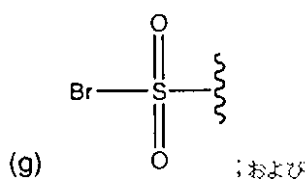
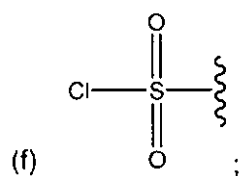
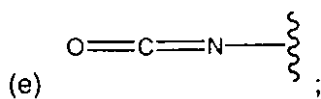
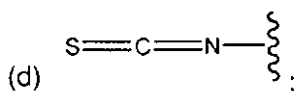
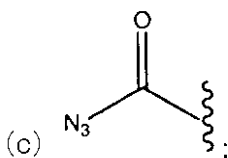
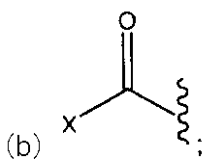
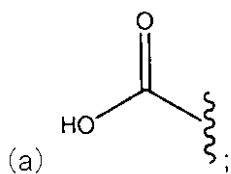
化学式 I I

式中、Y は、前記第 2 の反応基であり、Z は、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヘテロアリール、アリール、およびヘテロシクリルから選択され、P は、アミノ保護基から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

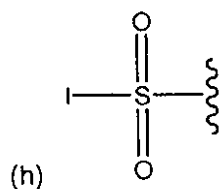
【請求項 6】

Y は、

【化 2】



## 【化 3】

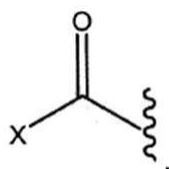


から選択され、式中、Xは、ハロゲン、アジド、アシルオキシ、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、およびヘテロシクリロキシから選択される、請求項5に記載の方法。

## 【請求項7】

Yは、(b)

## 【化 4】



である、請求項6に記載の方法。

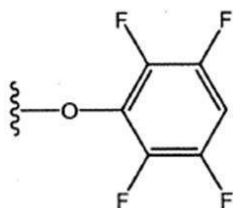
## 【請求項8】

Xは、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、およびヘテロシクリロキシから選択される、請求項7に記載の方法。

## 【請求項9】

Xは、

## 【化 5】

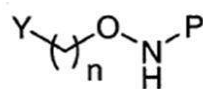


である、請求項8に記載の方法。

## 【請求項10】

前記アミノオキシ化合物は、化学式 I I I の化合物から選択され、

## 【化 6】



化学式 I I I

式中、Yは、第2の反応基であり、nは、1～10の範囲の整数から選択され、Pは、アミノ保護基から選択される、請求項5に記載の方法。

## 【請求項11】

nは、1である、請求項10に記載の方法。

## 【請求項12】

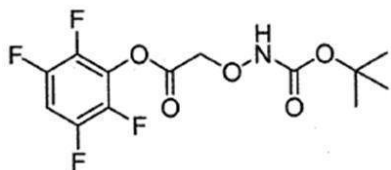
Yは、カルボキシル、エステル、ハロゲン化アシル、アシルアジド、ハロゲン化アルキル、無水物、イソチオシアナート、イソシアナート、またはハロゲン化スルホニル基であ

る、請求項 10 または 11 に記載の方法。

【請求項 13】

前記アミノオキシ化合物は、

【化 7】



である、請求項 12 に記載の方法。

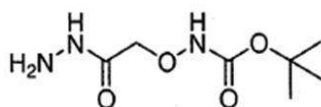
【請求項 14】

Y は、ヒドラジン、ヒドラジド、セミカルバジド、チオセミカルバジド、またはアミン基である、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 15】

前記アミノオキシ化合物は、

【化 8】

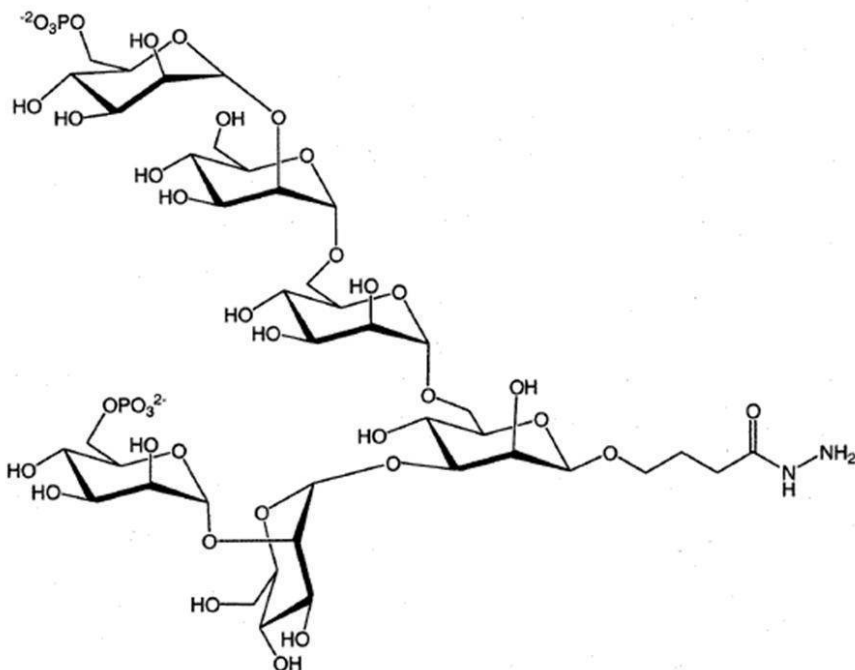


である、請求項 14 に記載の方法。

【請求項 16】

前記オリゴ糖は、

【化 9】



である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 17】

前記オリゴ糖は、

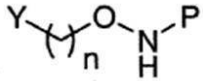
The chemical structure shows a branched oligosaccharide composed of several pyranose rings. The main chain consists of four pyranose rings linked by 1→3 glycosidic bonds. The third ring from the left has a 1→6 branch to a fifth pyranose ring. The first ring has a phosphate group ( $-O_3P^{2-}$ ) at the 2-position. The fourth ring has a 4-O-alkyl chain ending in a carboxylate group ( $-COO^-$ ). Hydroxyl groups are shown at various positions on the rings.

[illegible]

であるステップと、

(b) アミノオキシ基および第 2 の反応基を含むアミノオキシ化合物を提供するステップであって、前記アミノオキシ化合物は、化学式 I I I の化合物から選択され、

【化 1 2】



化学式 I I I

式中、n は、1 ~ 10 の範囲の整数から選択され、P は、アミノ保護基から選択され、Y は、前記第 2 の反応基であるステップと、

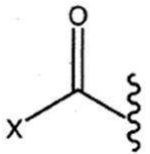
(c) 前記オリゴ糖の前記第 1 の反応基と、前記アミノオキシ化合物の前記第 2 の反応基とを反応させるステップと、

を含み、それによって、前記アミノオキシ基を含むオリゴ糖を調製する、方法。

【請求項 2 1】

Y は、

【化 1 3】

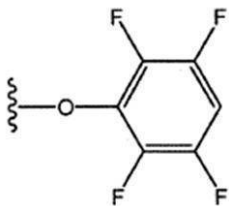


であり、式中、X は、ヒドロキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、およびヘテロシクリオキシから選択される、請求項 2 0 に記載の方法。

【請求項 2 2】

X は、

【化 1 4】

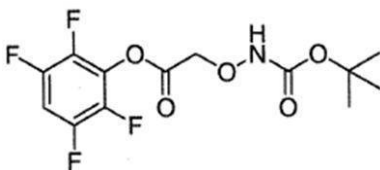


である、請求項 2 1 に記載の方法。

【請求項 2 3】

前記アミノオキシ化合物は、

【化 1 5】



である、請求項 2 2 に記載の方法。

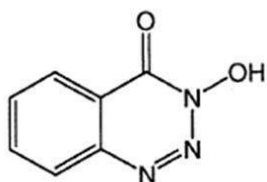
【請求項 2 4】

ステップ (c) は、結合試薬および / または触媒の存在下で、前記オリゴ糖の前記第 1 の反応基と、前記アミノオキシ化合物の前記第 2 の反応基とを反応させるステップを含む、請求項 2 0 ~ 2 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 2 5】

前記触媒は、

【化 1 6】



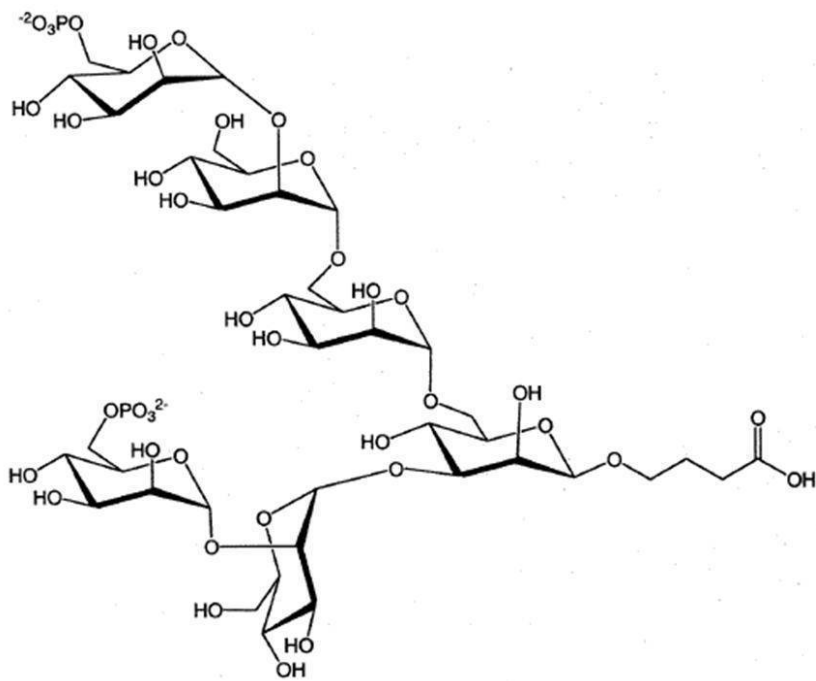
である、請求項 2 4 に記載の方法。

【請求項 2 6】

アミノオキシ基を含むオリゴ糖を調製する方法であって、

( a ) 第 1 の反応基を含むオリゴ糖を提供するステップであって、前記オリゴ糖は、

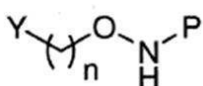
【化 1 7】



であるステップと、

( b ) アミノオキシ基および第 2 の反応基を含むアミノオキシ化合物を提供するステップであって、前記アミノオキシ化合物は、化学式 I I I の化合物から選択され、

【化 1 8】



化学式 I I I

式中、n は、1 ~ 10 の範囲の整数から選択され、P は、アミノ保護基から選択され、Y は、前記第 2 の反応基であるステップと、

( c ) 前記オリゴ糖の前記第 1 の反応基と、前記アミノオキシ化合物の前記第 2 の反応基とを反応させるステップと、

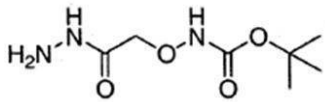
を含み、それによって、前記アミノオキシ基を含むオリゴ糖を調製する、方法。

【請求項 2 7】

Y は、ヒドラジン、ヒドラジド、アミノオキシ、チオセミカルバジド、セミカルバジド、またはアミン基である、請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 2 8】

前記アミノオキシ化合物は、  
【化 19】



である、請求項 27 に記載の方法。

【請求項 29】

ステップ(c)は、結合試薬および/または触媒の存在下で、前記オリゴ糖の前記第1の反応基と、前記アミノオキシ化合物の前記第2の反応基とを反応させるステップを含む、請求項 26 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 30】

前記結合試薬は、1 - エチル - 3 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - カルボジイミド (EDC) であり、前記触媒は、N - ヒドロキシスクシンイミド (NHS) である、請求項 29 に記載の方法。