

【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4年1月4日(2022.1.4)

【公表番号】特表2021-502986(P2021-502986A)  
【公表日】令和3年2月4日(2021.2.4)  
【年通号数】公開・登録公報2021-005  
【出願番号】特願2020-526527(P2020-526527)  
【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)  
A 6 1 K 31/519 (2006.01)  
A 6 1 K 45/00 (2006.01)  
A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
A 6 1 P 31/00 (2006.01)  
A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
A 6 1 P 37/06 (2006.01)  
A 6 1 P 31/04 (2006.01)  
A 6 1 P 31/16 (2006.01)  
A 6 1 P 31/12 (2006.01)  
A 6 1 P 33/00 (2006.01)  
A 6 1 P 33/06 (2006.01)  
A 6 1 P 37/08 (2006.01)  
A 6 1 P 31/10 (2006.01)  
A 6 1 K 39/39 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 4  
C 0 7 D 487/04 C S P  
A 6 1 K 31/519  
A 6 1 K 45/00  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 31/00  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 37/06  
A 6 1 P 31/04  
A 6 1 P 31/16  
A 6 1 P 31/12  
A 6 1 P 33/00  
A 6 1 P 33/06  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 31/10  
A 6 1 K 39/39

【手続補正書】

【提出日】令和3年11月15日(2021.11.15)

【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

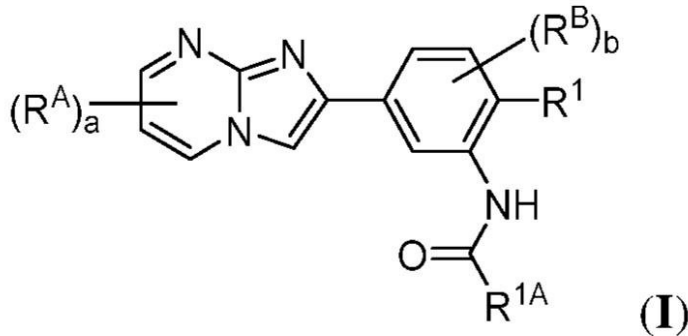
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)：

【化1】



で表される化合物、またはその薬学的許容し得る塩であり、式中：

$R^{1A}$ は、置換もしくは非置換のフェニル、または置換もしくは非置換のベンジル、または置換もしくは非置換の6員ヘテロアリールである；

$R^1$ は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換の $C_1 - 6$ アルキル、 $-OR^a$ 、または $-N(R^{a1})_2$ である；

$R^A$ の各場合は、ハロゲン、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアルキニル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、 $-OR^a$ 、 $-N(R^{a1})_2$ 、 $-SR^a$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)N(R^{a1})_2$ 、または $-NO_2$ である；

$R^B$ の各場合は、ハロゲン、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアルキニル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、 $-OR^a$ 、 $-N(R^{a1})_2$ 、 $-SR^a$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)N(R^{a1})_2$ 、または $-NO_2$ である；

$R^a$ の各場合は、独立して、水素、置換もしくは非置換のアシル、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアルキニル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、窒素原子へ付着されているとき窒素保護基、酸素原子へ付着されているとき酸素保護基、または硫黄原子へ付着されているとき硫黄保護基である；

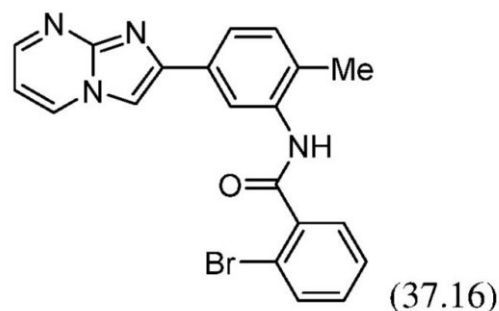
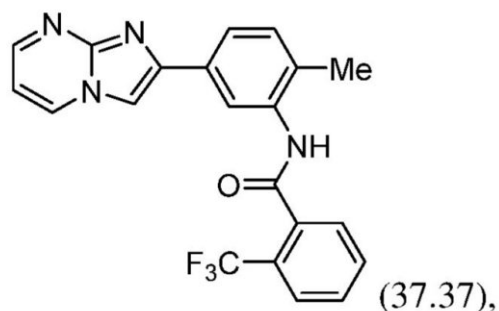
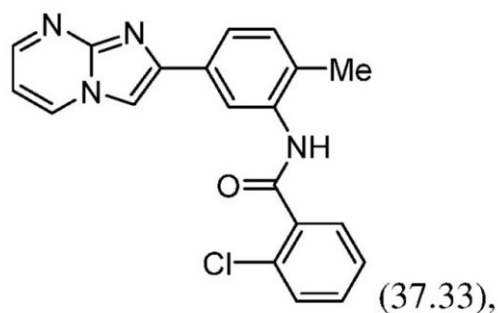
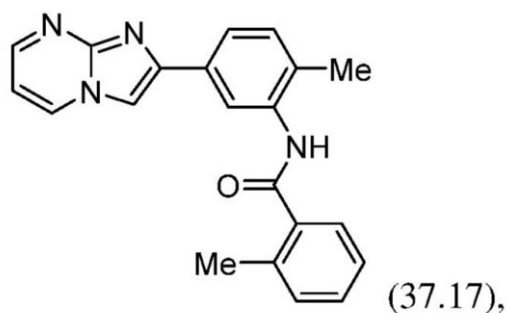
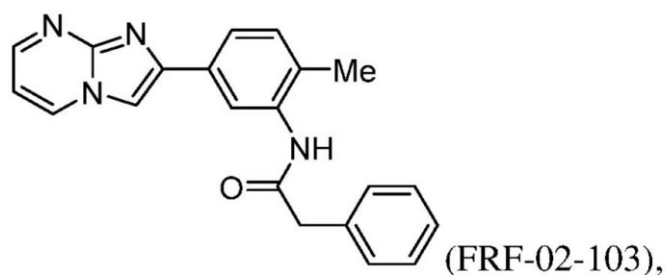
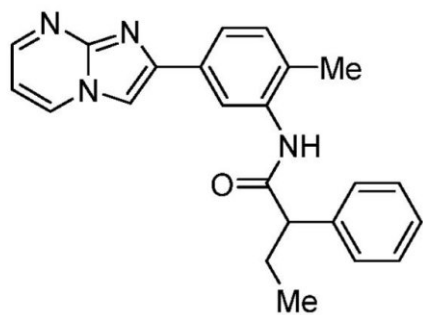
$R^{a1}$ の各場合は、独立して、水素、置換もしくは非置換のアシル、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアルキニル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、窒素原子へ付着されているとき窒素保護基であるか、あるいは、 $R^{a1}$ のうち2つの場合は、結び合うことで、置換もしくは非置換の複素環式の環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成する；

$a$ は、0、1、2、または3である；および

$b$ は、0、1、2、または3である；

ここで化合物は、式：

## 【化2】

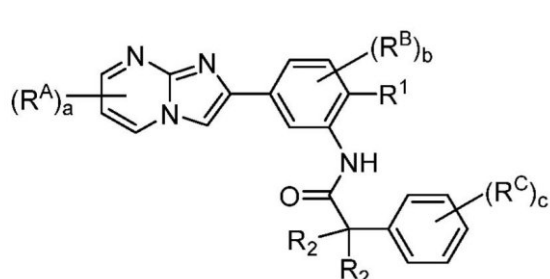


のいずれでも表されない、前記化合物。

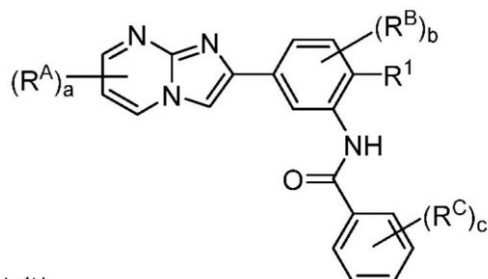
## 【請求項2】

化合物が、式：

## 【化3】



もしくは



で表されるか、またはその薬学的許容し得る塩であり、式中：

$R^2$ の各場合は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換の $C_1 - 6$ アルキル、 $-OR^a$ 、または $-N(R^{a1})_2$ である；

$R^C$ の各場合は、独立して、ハロゲン、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアルキニル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、 $-OR^a$ 、 $-N(R^{a1})_2$ 、 $-SR^a$ 、 $-CN$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=$

O) $N(R^{a1})_2$ 、または $-NO_2$ である；および

cは、0、1、2、3、4、または5である、請求項1に記載の化合物。

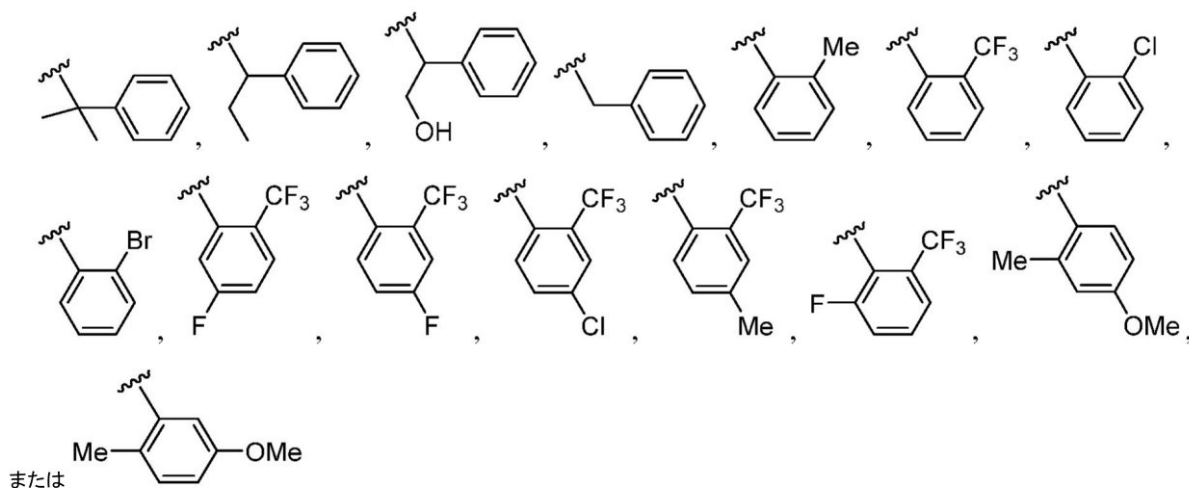
【請求項3】

$R^1$ が、ハロゲンまたは置換もしくは非置換の $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

$R^{1A}$ が、式：

【化4】



で表される、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項5】

$R^2$ のうち少なくとも1個の場合が、置換または非置換の $C_1 \sim 6$ アルキルである；任意に $R^2$ がMeまたはEtである、請求項2～4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

$R^A$ が、ハロゲン、置換もしくは非置換の $C_1 \sim 6$ アルキル、または $-O$ (置換もしくは非置換の $C_1 \sim 6$ アルキル)である、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

$R^A$ が、 $-F$ 、Me、または $-OMe$ である、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

aが、0または1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】

bが、0である、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

cが、0または1である、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

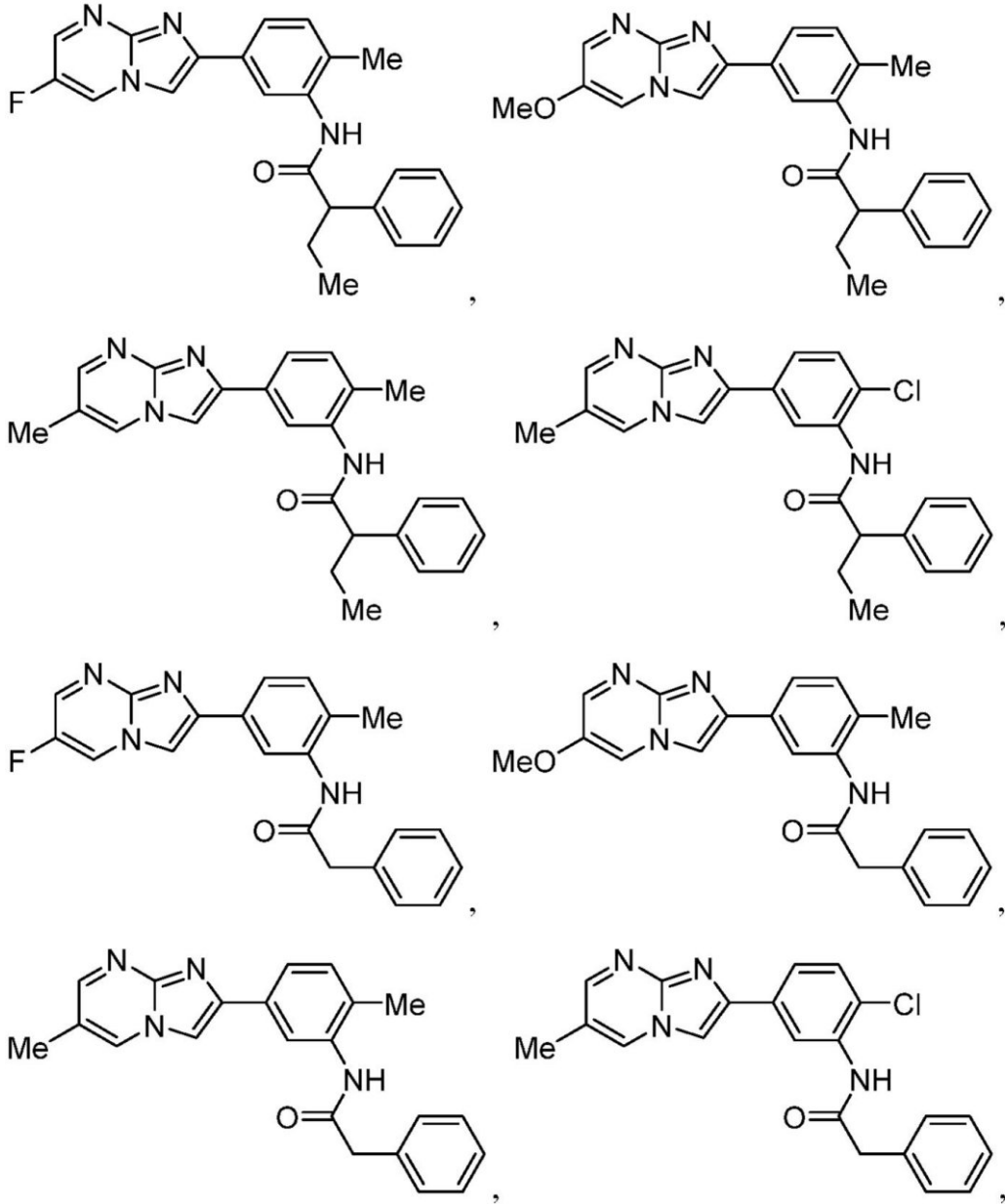
【請求項11】

$R^C$ が、ハロゲンまたは置換もしくは非置換の $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

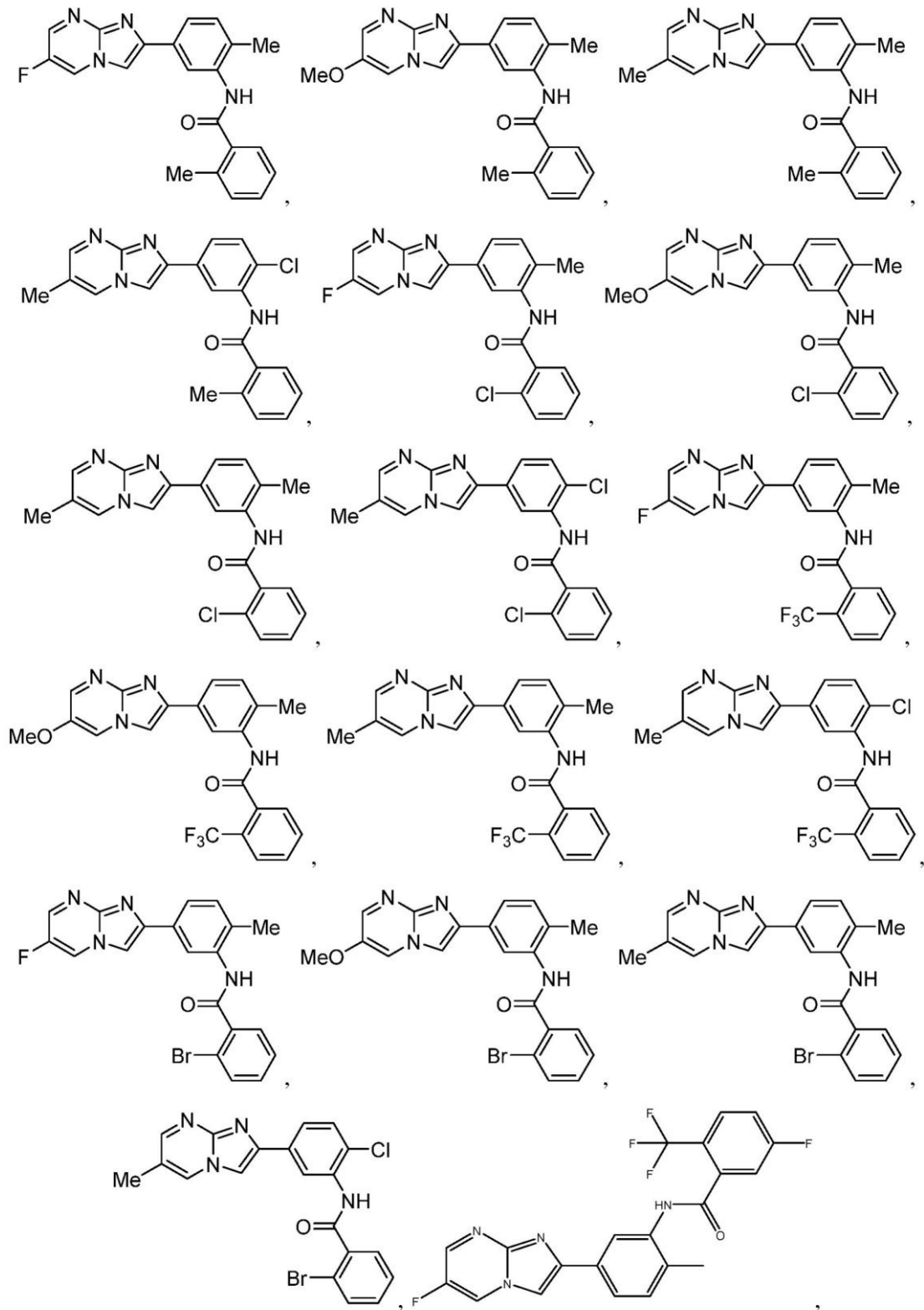
【請求項12】

化合物が、式：

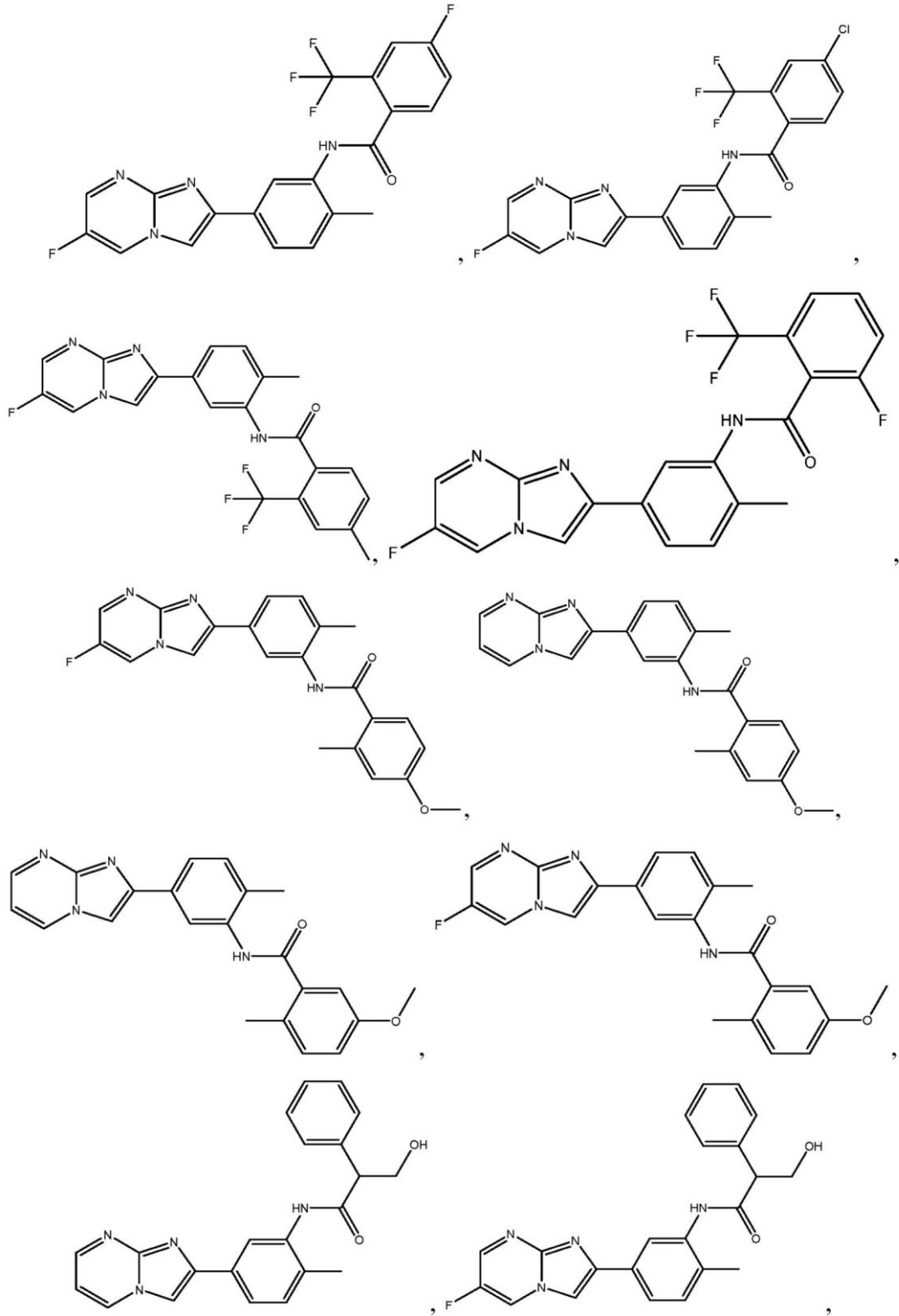
【化 5】



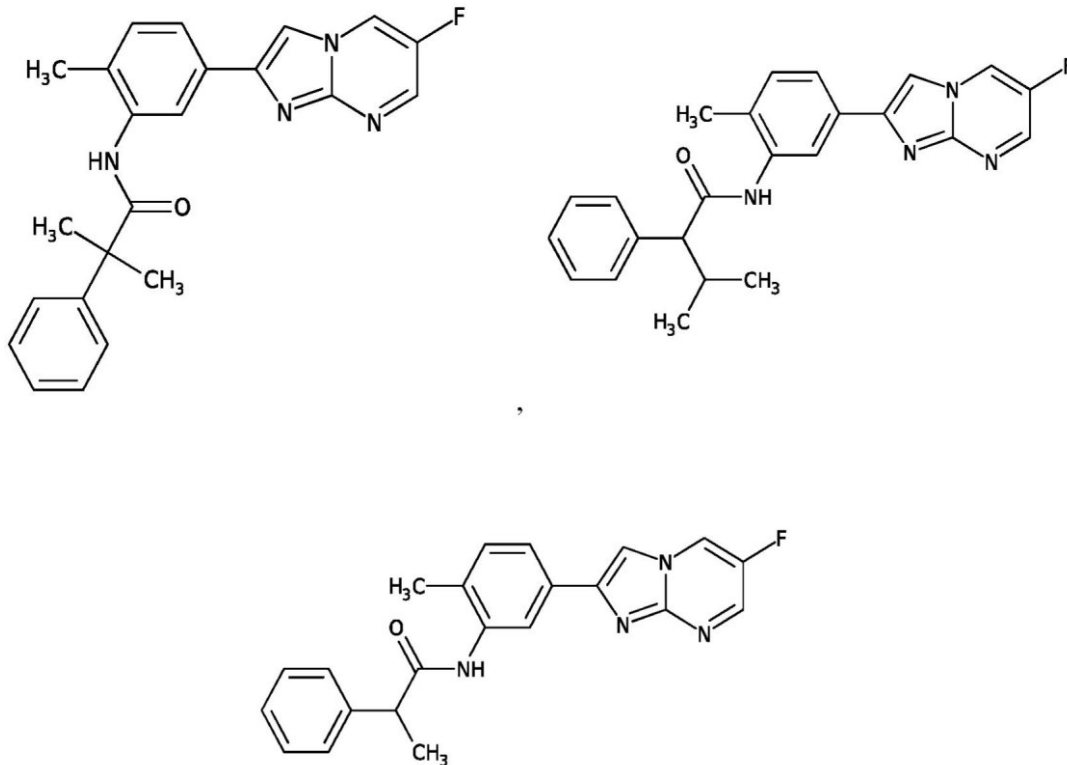
## 【化 6】



【化7】



## 【化 8】



で表されるか、またはその薬学的許容し得る塩である、請求項1～11のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項13】

請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物、および任意に、薬学的に許容し得る賦形剤を含む；任意に追加の医薬品をさらに含む、医薬組成物。

## 【請求項14】

これを必要とする対象における、疾患の処置における使用のための、請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物または請求項13に記載の医薬組成物であって、前記化合物または前記医薬組成物の治療的に有効な量を対象に投与することを含み、任意に化合物が、疾患のためのワクチン中のアジュバンドである、前記化合物または前記医薬組成物。

## 【請求項15】

- (i) 疾患が、増殖性疾患である；または
- (ii) 疾患が、炎症性疾患である；または
- (iii) 疾患が、自己免疫疾患である；または
- (iv) 疾患が、感染症であり、任意に感染症が、

(iv-a) ウイルス感染症；または

(iv-b) インフルエンザ；または

(iv-c) 敗血症；または

(iv-d) 小児感染症；または

(iv-e) 細菌感染症、さらに任意に、細菌感染症が、*Streptococcus* spp. または *Bordetella pertussis* での感染によって引き起こされるか、または細菌性感染因子が、炭疽病、ジフテリア、破傷風、*Bordetella* spp.、*Haemophilus influenzae* b型、*Neisseria* spp.、*Vibrio* spp.、コレラ、*Yersinia* spp.、*Staphylococci* spp.、*Streptococci* spp.、または *Salmonella* spp. である；または

(iv-f) マイコバクテリア感染症、さらに任意に、マイコバクテリア感染症が、結核

感染または非結核性抗酸菌症である；または

(iv-g) ウイルス感染症、さらに任意に、ウイルス感染症が、アデノウイルス、灰白髄炎、エボラ、ヘルペスウイルス、サイトメガロウイルス、水痘帯状疱疹ウイルス、麻疹、流行性耳下腺炎、風疹、A型肝炎、B型肝炎、C型肝炎、ヒトパピローマウイルス、インフルエンザ、狂犬病、日本脳炎、ロタウイルス、ヒト免疫不全ウイルス、呼吸器合胞体ウイルス、天然痘、黄熱病、またはジカウイルスによる感染症である；または

(iv-h) 寄生虫感染症、さらに任意に、寄生虫感染症が、マラリアまたはリーシュマニア症である；または

(iv-i) がん；または

(iv-j) アレルギー；または

(iv-k) 真菌感染症、さらに任意に、真菌感染症が、*Candida* spp.、*Aspergillus* sp.、*Cryptococcus* spp.、*Mucormycete*、*Blastomyces dermatitidis*、*Histoplasma capsulatum*、または *Sporothrix schenckii* による感染症である、

から選択される；または

(v) 疾患が、線維症である；または

(vi) 疾患が、心血管疾患である；または

(vii) 疾患が、移植片拒絶または移植片対宿主病である；または

(viii) ワクチンが、広範な病原体に対する異種の保護を提供する、

請求項14に記載の使用のための化合物または医薬組成物。

【請求項 16】

組成物が、

(i-a) 対象へ1度投与される；または

(i-b) 対象へ繰り返し投与される；および/または

(ii) 組成物が、皮内に、筋肉内に、腔内に、静脈内に、鼻腔内に、経口的に、皮下に、局所的に、および/または舌下に投与される；および/または

(iii) 組成物が、予防的なものとして投与される；および/または

(iv) 組成物が、別の免疫調節剤、免疫調節抗体、免疫調節生物製剤、または免疫応答を限定する分子経路のインヒビターとの併用治療として投与される、

請求項14または15に記載の使用のための化合物または医薬組成物。

【請求項 17】

対象が、

(i) ヒト未成年者である、任意に、

(i-a) ヒト未成年者が、投与時に28日齢未満である；または

(i-b) ヒト未成年者が、投与時に4日齢未満である；または

(i-c) ヒト未成年者が、投与時に2日齢未満である；または

(i-d) ヒト未成年者が、投与時に出生から24時間未満である；または

(i-e) 投与が、出生時に行われる；または

(i-f) 第2投与が、対象が28日齢以下であるときに行われる；または

(i-g) 第2投与が、対象が6月齢未満であるときに行われる；または

(i-h) 投与が、ヒト未成年者が2月齢、4月齢、および6月齢であるときに行われる；

または

(i-i) 未成年者が、低体重で生まれるか、または低出生体重を有する；または

(ii) ヒト成年者である；および/または

(iii) 対象が、免疫無防備状態である、

請求項14～16のいずれか一項に記載の使用のための化合物または医薬組成物。

【請求項 18】

これを必要とする対象における、免疫応答の増強における使用のための、請求1～12のいずれか一項に記載の化合物または請求項13に記載の医薬組成物であって、前記化合物または前記医薬組成物の治療的に有効な量を対象に投与することを含む、前記化合物または前記医薬組成物。

**【請求項 19】**

免疫調節物質としての使用のための、請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物または請求項13に記載の医薬組成物。

**【請求項 20】**

請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物または請求項13に記載の医薬組成物；および

化合物もしくは医薬組成物を対象へ投与するか、またはこれを生体試料に接触させるための指示を含む、キット。