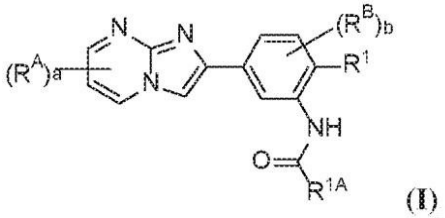
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和3年12月23日(2021.12.23)

【公表番号】特表2021-502988(P2021-502988A)
【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2020-526547(P2020-526547)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　39/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/02　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/002　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/112　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/106　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/235　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/245　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/25　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/20　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/29　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/145　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/205　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/15　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/015　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/008　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/62　(2017.01)
Ａ６１Ｋ　47/59　(2017.01)
Ａ６１Ｋ　47/52　(2017.01)
Ａ６１Ｋ　39/39　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/56　(2017.01)
Ａ６１Ｐ　37/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/69　(2017.01)
Ａ６１Ｋ　9/08　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　9/107　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/12　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　33/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　17/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　37/08　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　487/04　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　39/00　Ｈ
Ａ６１Ｋ　39/02
Ａ６１Ｋ　39/00　Ｋ
Ａ６１Ｋ　39/12

Ａ６１Ｋ　39/002
Ａ６１Ｋ　39/04
Ａ６１Ｋ　39/112
Ａ６１Ｋ　39/106
Ａ６１Ｋ　39/235
Ａ６１Ｋ　39/245
Ａ６１Ｋ　39/25
Ａ６１Ｋ　39/20
Ａ６１Ｋ　39/29
Ａ６１Ｋ　39/145
Ａ６１Ｋ　39/205
Ａ６１Ｋ　39/15
Ａ６１Ｋ　39/015
Ａ６１Ｋ　39/008
Ａ６１Ｋ　47/62
Ａ６１Ｋ　47/59
Ａ６１Ｋ　47/52
Ａ６１Ｋ　39/39
Ａ６１Ｋ　47/56
Ａ６１Ｐ　37/04
Ａ６１Ｋ　47/69
Ａ６１Ｋ　 9/08
Ａ６１Ｋ　 9/107
Ａ６１Ｐ　31/00
Ａ６１Ｐ　31/04
Ａ６１Ｐ　31/10
Ａ６１Ｐ　31/12
Ａ６１Ｐ　33/00
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｐ　35/04
Ａ６１Ｐ　17/00
Ａ６１Ｐ　37/08
Ｃ０７Ｄ　487/04　　１４４
Ｃ０７Ｄ　487/04　　ＣＳＰ

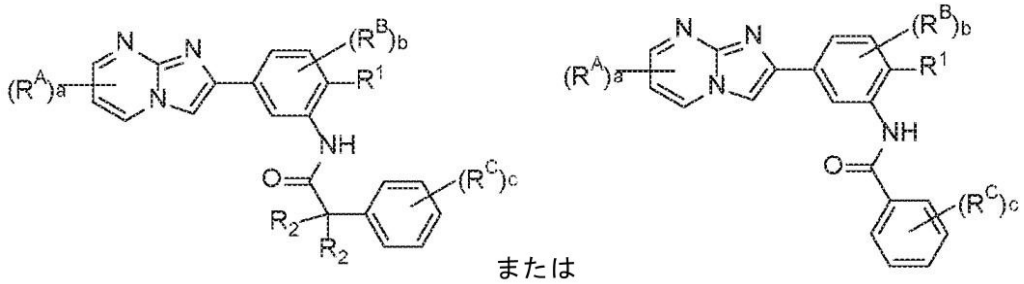
【手続補正書】
【提出日】令和3年11月15日(2021.11.15)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
抗原およびイミダゾピリミジン化合物を含む、組成物。
【請求項２】
ａ）抗原が、タンパク質またはポリペプチドを含む、および／または抗原が、タンパク質またはポリペプチドをコードする核酸を含む、任意で、核酸が、DNAまたはRNAである、および／またはさらに任意で
ｂ）イミダゾピリミジン化合物が、抗原へ抱合されている、またはイミダゾピリミジン化

合物が、抗原へ抱合されていない、任意で、イミダゾピリミジン化合物が、脂質付加されている、
請求項1に記載の組成物。
【請求項３】
抗原が、微生物病原体からのものである、任意で微生物病原体が、細菌、抗酸菌、真菌、ウイルス、寄生体、またはプリオンである、さらに任意で
a)細菌が、Bacillus anthracis、Bordetella pertussis、Corynebacterium diphtheriae、Clostridium tetani、Haemophilus influenzae b型、pneumococcus、Staphylococci spp.、Mycobacterium tuberculosis、Neiserria meningitidis、 Salmonella typhi、Vibrio cholerae、またはYersinia pestisである；
b)ウイルスが、アデノウイルス、灰白髄炎などのエンテロウイルス、エボラウイルス、単純ヘルペスウイルスなどのヘルペスウイルス、サイトメガロウイルスおよび水痘帯状疱疹、麻疹、流行性耳下腺炎、風疹、A型肝炎ウイルス、B型肝炎ウイルス、C型肝炎ウイルス、ヒトパピローマウイルス、インフルエンザウイルス、狂犬病、日本脳炎、ロタウイルス、ヒト免疫不全ウイルス(HIV)、呼吸器合胞体ウイルス(RSV)、天然痘、黄熱病、またはジカウイルスである；
c)寄生体が、Plasmodium spp.、Leishmania、または蠕虫である；または
d)真菌が、Candida spp.、Aspergillus spp.、Cryptococcus spp.、Mucormycete、Blastomyces dermatitidis、Histoplasma capsulatum、またはSporothrix schenckiiである；
請求項1または2に記載の組成物。
【請求項４】
抗原が、がん特異的抗原である、任意で、抗原が、がん特異的抗原に由来するヘテロクリティックエピトープまたは潜在性エピトープである、さらに任意で、がん特異的抗原が、ネオ抗原である、先行する請求項の記載のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項５】
抗原が、リポ多糖(LPS)を含む、請求項1に記載の組成物。
【請求項６】
イミダゾピリミジン化合物が、式(I)：
【化１】



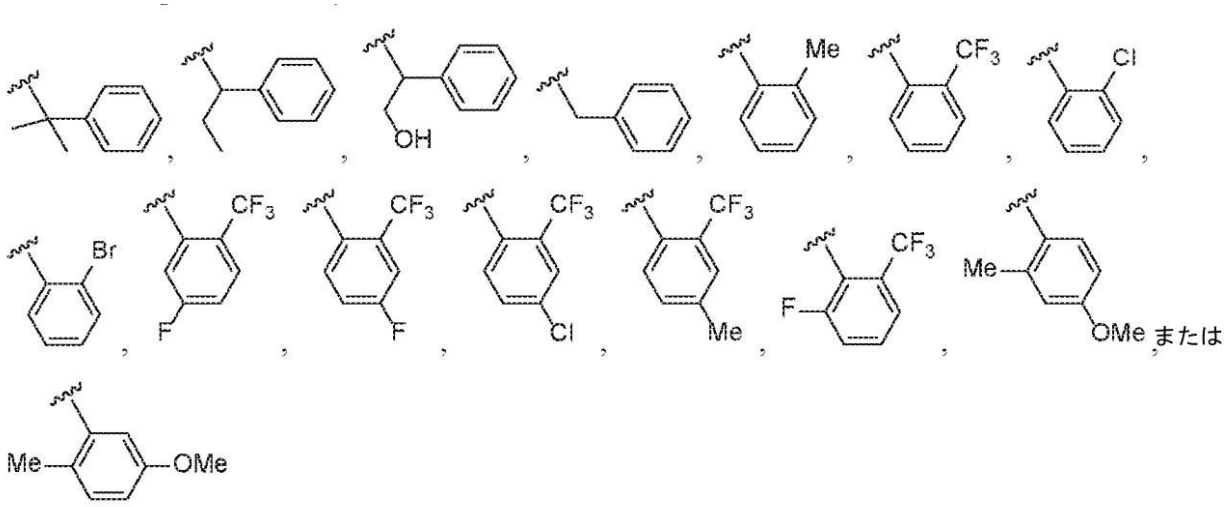
で表されるか、またはその薬学的に許容し得る塩であり、式中：
R^{1A}は、置換もしくは非置換のフェニル、または置換もしくは非置換のベンジル、または置換もしくは非置換の6員ヘテロアリールである；
R^{1}は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換の$C_{1\sim6}$アルキル、$-OR^{a}$、または$-N(R^{a1})_2$である；
R^{A}の各場合は、ハロゲン、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアルキニル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、$-OR^{a}$、$-N(R^{a1})_2$、$-SR^{a}$、-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、2個のR^{a1}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、
請求項1～5のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項７】
化合物が、式：
【化２】



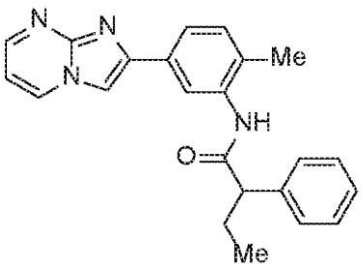
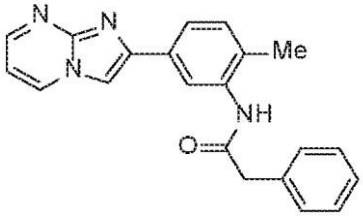
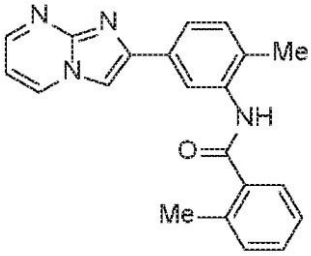
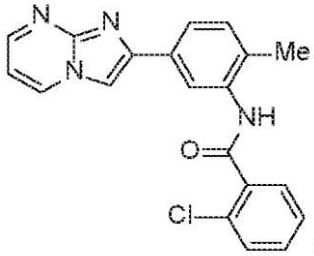
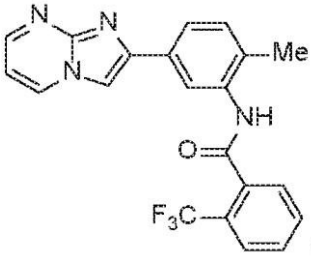
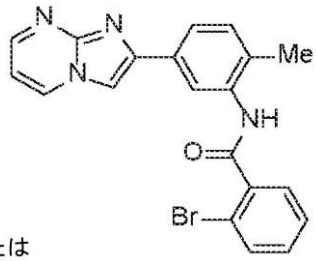
で表されるか、またはその薬学的に許容し得る塩であり、式中：
R^2の各場合は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換の$C_{1～6}$アルキル、-OR^a、または-$N(R^{a1})_2$である；
R^Cの各場合は、独立して、ハロゲン、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアルキニル、置換もしくは非置換のカルボシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、-OR^a、-$N(R^{a1})_2$、-SR^a、-CN、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)$N(R^{a1})_2$、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；任意で
(i)R^1が、ハロゲンまたは置換もしくは非置換の$C_{1～6}$アルキルである；
(ii)R^{1A}が、式：

【化３】



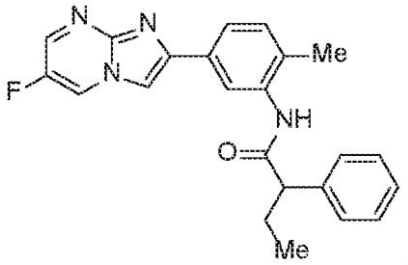
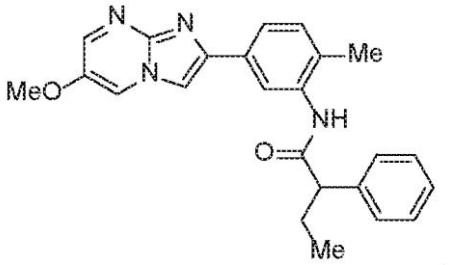
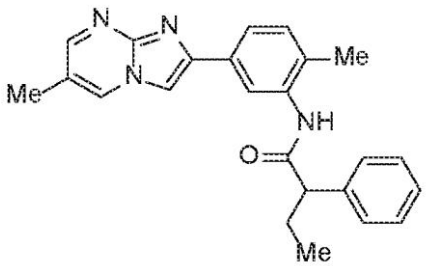
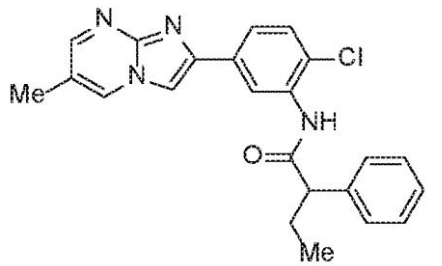
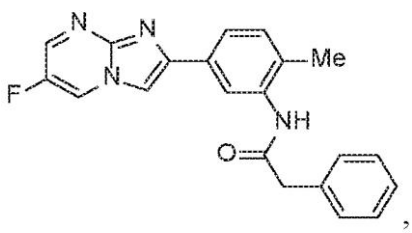
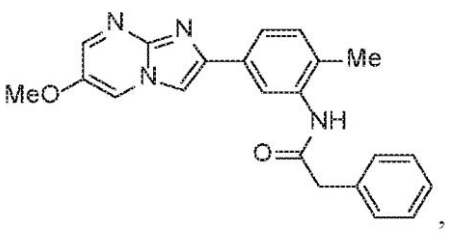
で表される；または
(iii)R^2のうち少なくとも1つの場合が、
(a)置換または非置換の$C_{1\sim6}$アルキルである；
(b)MeまたはEtである；または
(iv)R^Aが：
(a)ハロゲン、置換もしくは非置換の$C_{1\sim6}$アルキル、または-O(置換もしくは非置換の$C_{1\sim6}$アルキル)である；
(b)-F、Me、または-OMeである；および／または
(v)aが、
(a)1である、または
(b)0である；
(vi)bが、0である；および／または
(vii)cが：
(a)1である；または
(b)0である；
請求項6に記載の組成物。
【請求項８】
R^Cが、ハロゲンまたは置換もしくは非置換の$C_{1\sim6}$アルキルである；任意で
化合物が、式：

【化４】

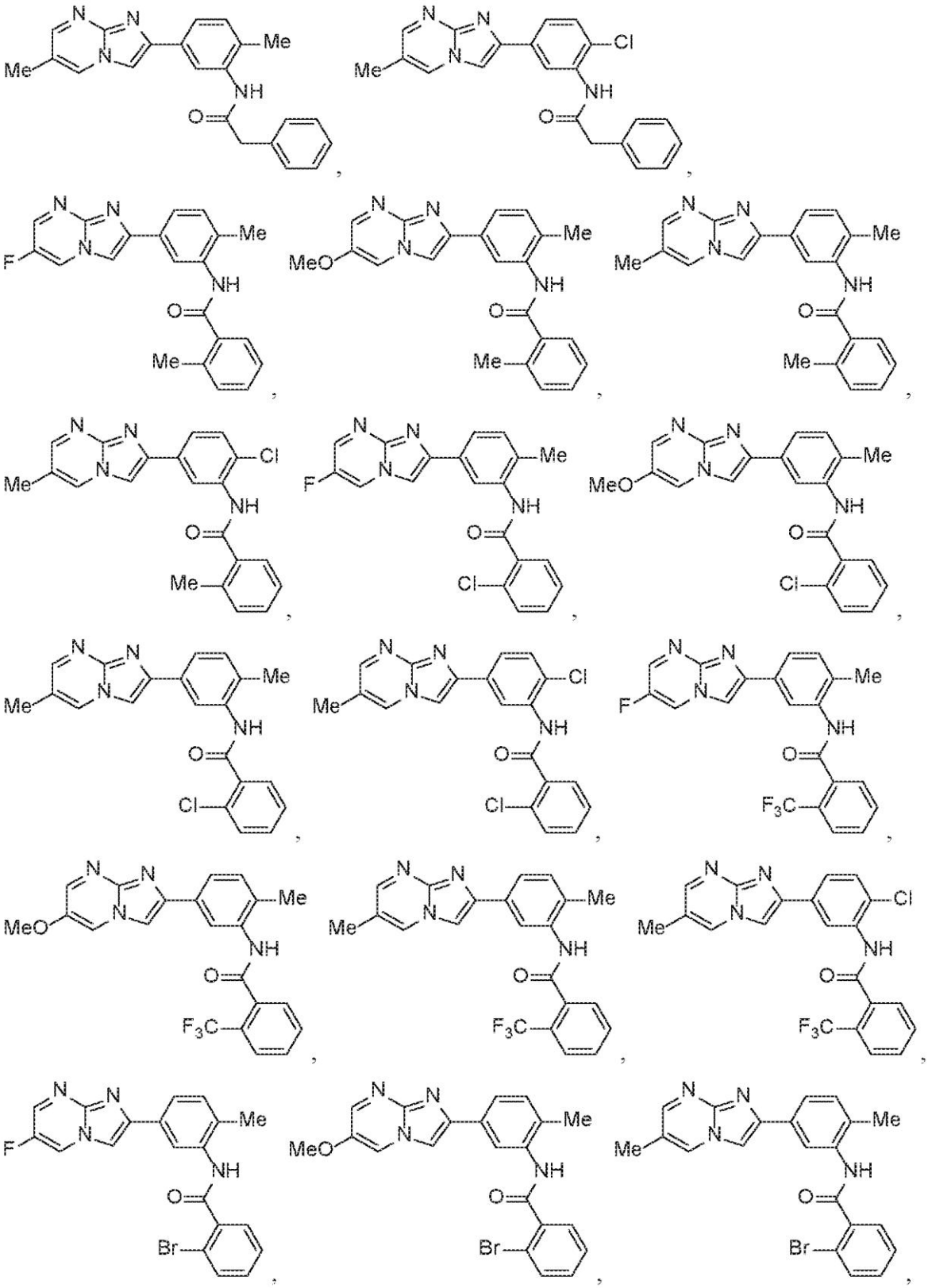

(037),

(FRF-02-103),

(37.17),

(37.33),

(37.37),または

(37.16)

で表されるか；または
化合物が、式：

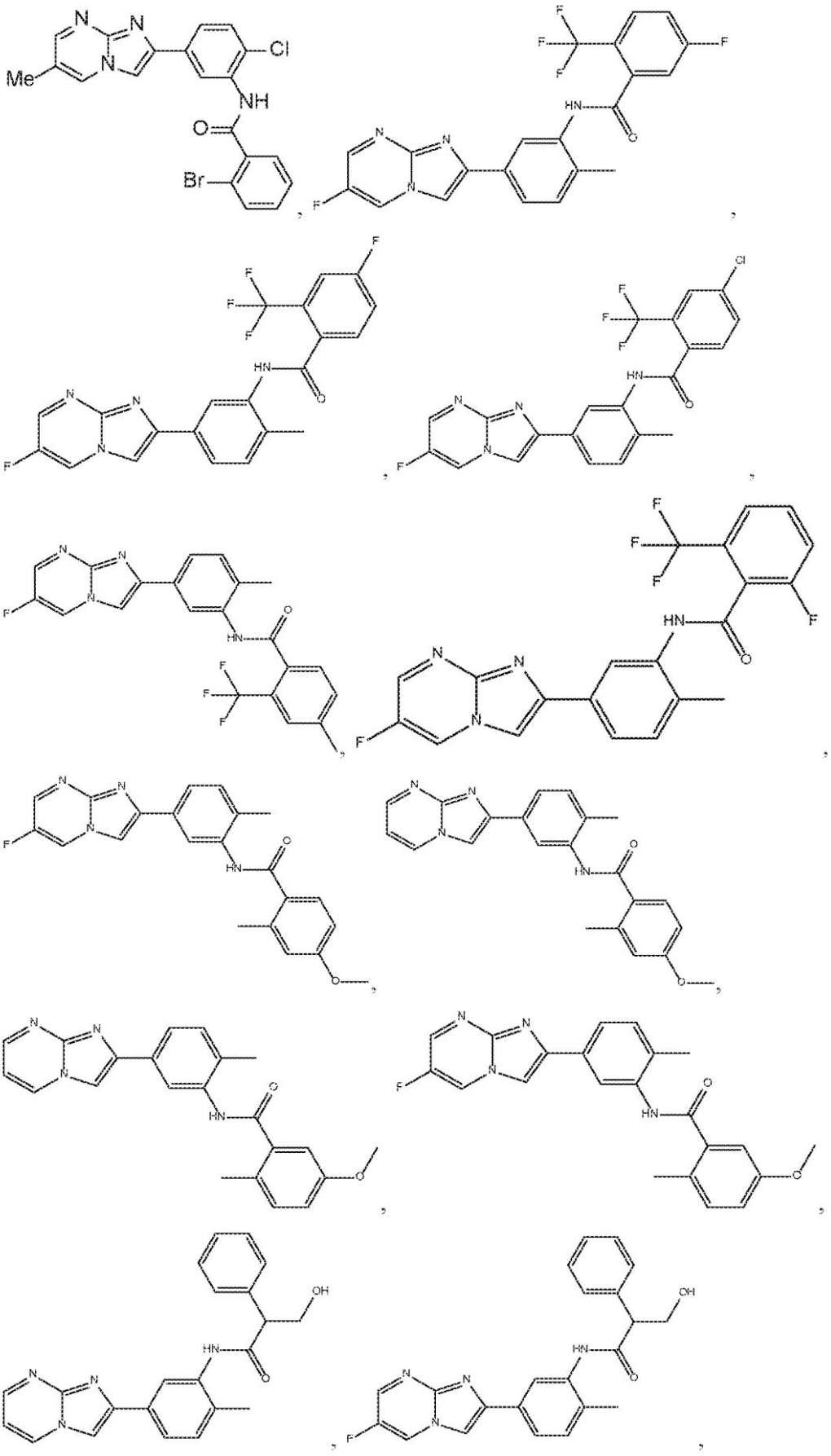
【化５】


,

,

,

,

,

,

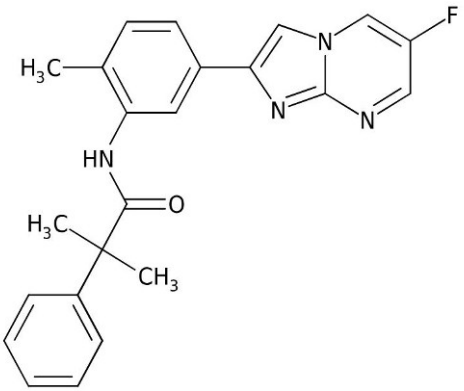
【化６】



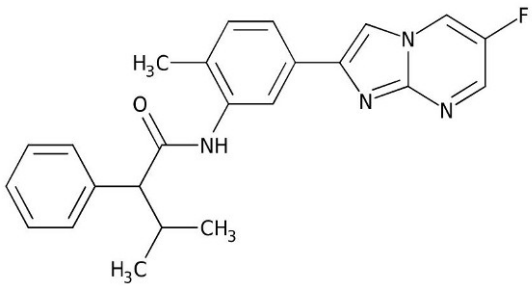
【化７】



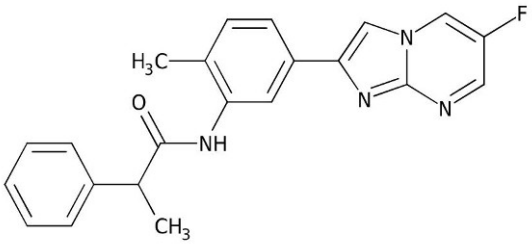
【化８】



,



,



で表されるか、またはその薬学的に許容し得る塩である、請求項1～7(vii)(a)のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項９】

組成物が、ワクチン組成物であり、任意で：

(i)イミダゾピリミジン化合物が、アジュバントである；および／または

(ii)抗原が、ミョウバン上へ吸着されている；および／または

(iii)イミダゾピリミジン化合物が、ミョウバン上へ吸着されている；および／または

(iv)ワクチン組成物が、第2アジュバントをさらに含む、さらに任意で

(a)第2アジュバントは、トール様受容体(TLRs)、NOD様受容体(NLRs)、RIG-I様受容体、C型レクチン受容体(CLRs)、またはインターフェロン遺伝子刺激因子(STING)などのパターン認識受容体(PRRs)のアゴニストである；および／または

(b)第2アジュバントが、ミョウバンへ結合または吸着されている；および／または

(c)第2アジュバントが、ミョウバンである；および／または

(d)第2アジュバントが、エマルションである；

請求項1～8のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項１０】

抗原と、イミダゾピリミジン化合物を含むアジュバントとを含むワクチンであって、任意で

ワクチンが、サブユニットワクチン、弱毒化ワクチン、または結合型ワクチンである、さらに任意で

ワクチン組成物が、アジュバント系を含む、なおさらに任意で

アジュバント系が、2種以上のアジュバントを含む、

前記ワクチン。

【請求項１１】

抗原に対する免疫応答の増強を、これを必要とする対象においてする方法における使用

のための、有効量の抗原および有効量のイミダゾピリミジン化合物であって、任意で、方法は第2アジュバントの使用をさらに含む；任意で第2アジュバントは請求項9で定義されるものである、前記使用のための有効量の抗原および有効量のイミダゾピリミジン化合物。

【請求項１２】

抗原が、請求項1～5のいずれか一項に記載のものである、任意で

抗原が、ミョウバン上へ吸着されている；および／または

イミダゾピリミジン化合物が、請求項6～8のいずれか一項に記載のものである、任意で

イミダゾピリミジン化合物が、ミョウバン上へ吸着されている；

請求項11に記載の使用のための有効量の抗原および有効量のイミダゾピリミジン化合物。

【請求項１３】

イミダゾピリミジン化合物が、対象において、抗原が単独で投与されたときと比較して、抗原に対する防御効果を長引かせる：任意で

(i)イミダゾピリミジン化合物が、抗原が単独で投与されたときと比較して、免疫応答速度を増大させる；

(ii)抗原がイミダゾピリミジン化合物の存在下であると、抗原が単独で投与されたときと比較して、抗原に対して同じレベルの免疫応答をより低用量にて産生する；および／または

(iii)対象が、感染性疾患を有するか、またはこれを発症するリスクがある；任意で：

(a)感染性疾患が、細菌、抗酸菌、真菌、ウイルス、寄生体、またはプリオンによって引き起こされる；および／または

(b)感染性疾患が、敗血症である；または

(iv)対象が、がんを有するか、またはこれを発症するリスクがある；任意で

(a)がんが、転移性がんである；および／または

(b)がんが、黒色腫である；または

(v)対象が、アレルギーを有するか、またはこれを発症するリスクがある；

請求項11～12のいずれか一項に記載の使用のための有効量の抗原および有効量のイミダゾピリミジン化合物。

【請求項１４】

投与することが、全身的にまたは局部的になされる；任意で

(i)(a)投与することが、筋肉内に、皮内に、経口的に、静脈内に、局所的に、鼻腔内に、膣内に、または舌下になされる；および／または

(b)投与が、予防的なものである；および／または

(c)対象が、免疫無防備状態にある；および／または

(ii)対象が、伴侶動物または研究動物である；

(iii)対象が、ヒト新生児、未成年者、成年者、または高齢者である；任意で

(a)対象が、低体重で生まれるか、または低出生体重を有する；および／または

(b)対象が、ヒト新生児である；

(c)対象が、高齢者である；任意で投与が、対象が年齢65歳より高いときに行われる；

(d)対象が、ヒト成年者である；または

(e)対象が、ヒト未成年者である、任意で

(aa)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

(bb)ヒト未成年者が、投与時に28日齢未満である；任意で

(cc)ヒト未成年者が、投与時に、出生から(of age)24時間未満である；任意で第2の投与が、対象が28日齢以下であるときに行われる；または第2の投与が、対象が6月齢未満であるときに行われる；または

(dd)投与が、出生時に行われ(occurs)；任意で第2の投与が、対象が28日齢以下であるときに行われる；または第2の投与が、対象が6月齢未満であるときに行われる；

請求項11～13のいずれか一項に記載の使用のための有効量の抗原および有効量のイミダゾピリミジン化合物。

【請求項１５】
対象にワクチン接種をする方法、または疾患の処置を、これを必要とする対象においてする方法における使用のための、請求項1～9のいずれか一項に記載の組成物、または請求項10に記載のワクチン。
【請求項１６】
免疫応答の増強を、これを必要とする対象においてする方法における使用のための有効量のイミダゾピリミジン化合物であって；任意で
(i)免疫応答が、自然免疫応答である；および／または
(ii)イミダゾピリミジン化合物が、末梢血単核球(PBMC)を活性化する；および／または
(iii)イミダゾピリミジン化合物が、パターン認識受容体(PRR)を活性化する；任意で
(a)PRRが、トール様受容体、NOD様受容体、RIG-I様受容体、C型レクチン受容体、およびSTINGからなる群から選択される；任意でトール様受容体が、トール様受容体-1、-2、-3、-4、-5、-6、-9、-10である；任意でトール様受容体が、トール様受容体-7または-8である；および／または
(iv)イミダゾピリミジン化合物が、対象における炎症促進性サイトカインの産生を誘導する；任意で
(a)炎症促進性サイトカインが、TNF、IL-12、IL-6、またはIL1-βである、
前記有効量のイミダゾピリミジン化合物。