

【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 1 部門第 1 区分

【発行日】平成23年10月27日 (2011.10.27)

【公表番号】特表2010-519915(P2010-519915A)

【公表日】平成22年6月10日 (2010.6.10)

【年通号数】公開・登録公報2010-023

【出願番号】特願2009-552038(P2009-552038)

【国際特許分類】

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

C 1 2 N 15/117 (2010.01)

A 6 1 K 39/00 (2006.01)

A 6 1 K 48/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

【 F I 】

C 1 2 N 15/00 Z N A A

C 1 2 N 15/00 J

A 6 1 K 39/00 H

A 6 1 K 48/00

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 37/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/38

【手続補正書】

【提出日】平成23年9月9日 (2011.9.9)

【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

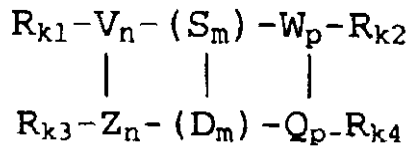
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式の化合物：

【化 1】



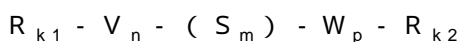
式 IIa

(式中、

- n は 0 ~ 10 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であって、n = 0 という条件では、p = 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であり；
- p は 0 ~ 10 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であって、p = 0 という条件では、n = 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であり；
- V、Z、Q および W は、いずれかのヌクレオシド、リボヌクレオシド、デオキシリボヌクレオシド、ヌクレオシドアナログ、リボヌクレオシドアナログまたはデオキシリボヌクレオシドアナログであり；
- m は 1 ~ 500 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であり；
- S は、イノシン、イノシンアナログヌクレオシド、アデニンまたはアデニンアナログヌクレオシドであり；
- D は、シトシン、シトシンアナログヌクレオシド、ウラシルまたはウラシルアナログヌクレオシドであり；
- k_1 、 k_2 、 k_3 および k_4 は、独立して、0 ~ 10 を含めたいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの整数であり；
- R は、独立して、ヌクレオシド間結合基によってジェミナルヌクレオシドに結合されたいずれかのリボヌクレオシドであるか、または R は不在であり；かつ
- V、S、D、Z、Q、R および W のうちの 1 つ以上は、1 つ以上のロックされた核酸 (LNA) モノマーを含む。)。

【請求項 2】

次式の化合物：



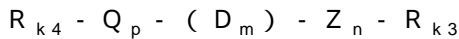
式 I V c

(式中、

- n は 0 ~ 10 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であって、n = 0 という条件では、p = 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であり；
- p は 0 ~ 10 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であって、p = 0 という条件では、n = 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であり；
- V および W は、いずれかのヌクレオシド、リボヌクレオシド、デオキシリボヌクレオシド、ヌクレオシドアナログ、リボヌクレオシドアナログまたはデオキシリボヌクレオシドアナログであり；
- m は 1 ~ 500 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であり；
- S は、イノシン、イノシンアナログヌクレオシド、アデニンまたはアデニンアナログヌクレオシドであり；
- k_1 および k_2 は、独立して、0 ~ 10 を含めたいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの整数であり；
- R は、独立して、ヌクレオシド間結合基によってジェミナルヌクレオシドに結合されたいずれかのリボヌクレオシドであるか、または R は不在であり；かつ
- V、S、R および W のうちの 1 つ以上は、1 つ以上のロックされた核酸 (LNA) モノマーを含む。)。

【請求項 3】

次式の化合物



式 I V d

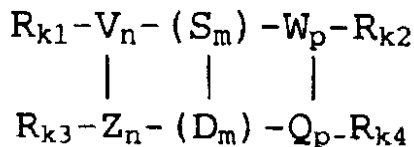
(式中、

- n は 0 ~ 10 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であって、n = 0 という条件では、p = 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であり；
- p は 0 ~ 10 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であって、p = 0 という条件では、n = 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であり；
- Z および Q は、いずれかのヌクレオシド、リボヌクレオシド、デオキシリボヌクレオシド、ヌクレオシドアナログ、リボヌクレオシドアナログまたはデオキシリボヌクレオシドアナログであり；
- m は 1 ~ 500 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であり、
- D は、シトシン、シトシンアナログヌクレオシド、ウラシルまたはウラシルアナログヌクレオシドであり；
- k₃ および k₄ は、独立して、0 ~ 10 を含めたいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの整数であり；
- R は、独立して、ヌクレオシド間結合基によってジェミナルヌクレオシドに結合されたいずれかのリボヌクレオシドであるか、または R は不在であり、かつ；
- R、Z、D および Q のうちの 1 つ以上は、1 つ以上のロックされた核酸 (LNA) モノマーを含む。)。

【請求項 4】

次式の化合物

【化 2】



式 IIa

(式中、

- n は 0 ~ 10 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であって、n = 0 という条件では、p = 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であり；
- p は 0 ~ 10 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であって、p = 0 という条件では、n = 1、2、3、4、5、6、7、8、9 または 10 であり；
- V、W、Z および Q はいずれかのヌクレオシドであり；
- m は 1 ~ 500 のいずれかの整数であり、
- S は、イノシン、イノシンアナログヌクレオシド、アデニンまたはアデニンアナログヌクレオシドであり；
- D は、シトシン、シトシンアナログヌクレオシド、ウラシルまたはウラシルアナログヌクレオシドであり；
- k₁、k₂、k₃ および k₄ は、独立して、0 ~ 10 を含めたいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの整数であり；
- R は、独立して、ヌクレオシド間結合基によってジェミナルヌクレオシドに結合されたいずれかのリボヌクレオシドであるか、または R は不在であり、かつ；
- V、S、W、Z、D および Q のうちの 1 つ以上は、1 つ以上の LNA モノマーを含む) を製造する方法であって、

請求項 2 に記載の化合物に従うオリゴマーを、請求項 3 に記載の化合物に従うオリゴマーと、約 0.5 - 1.0 から約 1.0 - 0.5 のモル比で混合する工程と、前記第 1 のオリゴマーおよび前記第 2 のオリゴマーをアニールして二本鎖化合物を形成する工程とを含む

方法。

【請求項 5】

S がイノシンであり、D がシトシンである、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

請求項 5 に記載の化合物、ポリ - L - リジンおよびカルボキシメチルセルロースを含む組成物。

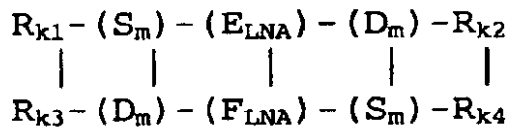
【請求項 7】

請求項 5 に記載の化合物および免疫原を含む組成物。

【請求項 8】

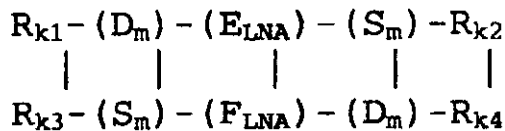
次式の化合物

【化 3】



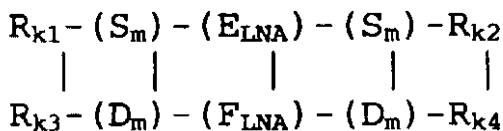
式 VIa

【化 4】



式 VIb

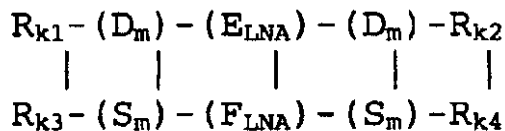
【化 5】



式 VIc

または、

【化 6】



式 VIId

(式中、

- E_{LNA} は、C p G または C p G モチーフであり、ここで前記 C p G または前記 C p G モチーフを含むヌクレオシド、C、G のうちの 1 つ以上は LNA であり；
- F_{LNA} は、C p G または C p G モチーフであり、ここで前記 C p G または前記 C p G モチーフを含むヌクレオシド、C、G のうちの 1 つ以上は LNA であり；
- m は 1 ～ 500 のいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの量であり；
- S は、イノシン、イノシンアナログヌクレオシド、アデニンまたはアデニンアナログヌクレオシドであり；
- D は、シトシン、シトシンアナログヌクレオシド、ウラシルまたはウラシルアナログヌクレオシドであり；

- k_1 、 k_2 、 k_3 および k_4 は、独立して、0 ~ 10を含めたいずれかの整数、またはそれらの間のいずれかの整数であり；
- Rは、独立して、ヌクレオシド間結合によって結合されたいずれかのリボヌクレオシドである。)。

【請求項 9】

S がイノシンであり、D がシトシンである、請求項 8 に記載の式 V I a、V I b、V I c または V I d に従う化合物。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の化合物および免疫原を含む組成物。

【請求項 11】

1 ~ 500 のイノシン、シトシン、またはイノシンリボヌクレオチドおよびシトシンリボヌクレオチドの組合せ、ならびに 1 ~ 10 のロックされた核酸残基を含む第 1 の一本鎖ヌクレオチドポリマーと；

1 ~ 500 のイノシン、シトシン、またはイノシンリボヌクレオチドおよびシトシンリボヌクレオチドの組合せ、ならびに 1 ~ 10 のロックされた核酸残基を含む第 2 の一本鎖ヌクレオチドポリマーとを含み；

前記第 1 の一本鎖ヌクレオチドポリマーおよび前記第 2 の一本鎖ヌクレオチドポリマーが水素結合して二本鎖核酸を形成し、前記二本鎖核酸が二本鎖ポリ IC 領域およびロックされた核酸残基を含む二本鎖領域を含むことを特徴とする化合物。

【請求項 12】

1 ~ 500 のイノシン、シトシン、またはイノシンリボヌクレオチドおよびシトシンリボヌクレオチドの組合せ、ならびに配列番号：23 に従う核酸配列を含む第 1 の一本鎖ヌクレオチドポリマーと；

1 ~ 500 のイノシン、シトシン、またはイノシンリボヌクレオチドおよびシトシンリボヌクレオチドの組合せ、ならびに配列番号：24 に従う核酸配列を含む第 2 の一本鎖ヌクレオチドポリマーとを含み；

前記第 1 の一本鎖ヌクレオチドポリマーおよび前記第 2 の一本鎖ヌクレオチドポリマーが水素結合して二本鎖核酸を形成し、前記二本鎖核酸が二本鎖ポリ IC 領域およびロックされた核酸残基を含む二本鎖領域を含むことを特徴とする化合物。

【請求項 13】

請求項 11 に記載の化合物を含むアジュバント組成物。

【請求項 14】

請求項 12 に記載の化合物を含むアジュバント組成物。

【請求項 15】

請求項 12 に記載の化合物を含む、TLR3 および TLR9 のアゴニスト。