

【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30年6月14日 (2018.6.14)

【公表番号】特表2017-515898(P2017-515898A)

【公表日】平成29年6月15日 (2017.6.15)

【年通号数】公開・登録公報2017-022

【出願番号】特願2017-511557(P2017-511557)

【国際特許分類】

C 0 7 H 3/06 (2006.01)

C 0 7 H 15/04 (2006.01)

C 0 7 H 15/26 (2006.01)

C 0 7 H 23/00 (2006.01)

C 0 8 B 37/00 (2006.01)

C 0 7 H 15/14 (2006.01)

C 0 7 H 13/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 3/06 C S P

C 0 7 H 15/04 A

C 0 7 H 15/04 C

C 0 7 H 15/04 E

C 0 7 H 15/26

C 0 7 H 23/00

C 0 7 H 15/04 Z

C 0 7 H 15/04 D

C 0 8 B 37/00 Z

C 0 7 H 15/14

C 0 7 H 13/06

A 6 1 P 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成30年5月2日 (2018.5.2)

【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】

以下の一般式 (I)

(I)

n は 1 ~ 18 の整数であり ;

Bは CH_2OH 、 CHO 、または CO_2H であり；

A は、

(a) O R または S R (R は、場合によって置換されたアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、またはヘテロ脂肪族である) ;

(b)

\bigcirc アルキル

 (W)

(V)

(式中、R ' は、場合によって置換されたアルキル、アリール、もしくはヘテロアリールである) ；

(c)

O[C@H]1[C@@H](O)[C@H](O)[C@@H](O)[C@H](O)[C@H]1O (X)

(X)

(式中、 R_1 はHであり；そして R_2 は場合によって置換されたアルケニル、アルキニル、もしくはヘテロ脂肪族である；または

R₂ は H であり；そして R₁ は 場合によって置換された アルケニル、アルキニル、もしくはヘテロ脂肪族である；そして

a は、0、1、2、3、4、または5である) ;

(d)

R-N-アジドアルキル

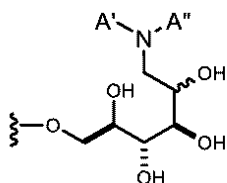
(式中、

R は、H であるか、または場合によって置換されたアルキル、またはアリールである、
そして

アジドアルキルは、アジド部分を含むアルキル基である）；

(e)

【化 1 4 8】

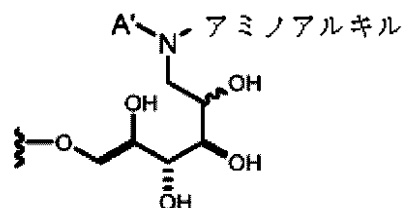


(式中、

A' は場合によって置換されたアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり； A'' はカルボキシアルキル、カルボキシアリール、またはカルボキシヘテロアリールであり；カルボキシアルキルは脂肪族アミノ酸から形成される残基を表し；カルボキシアリールは芳香族アミノ酸から形成される残基を表し；そしてカルボキシヘテロアリールはヘテロ芳香族アミノ酸から形成される残基を表す）；

(f)

【化 1 4 9】



(式中、

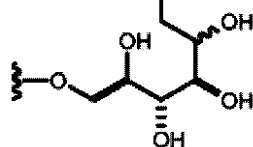
A' は場合によって置換されたアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；そしてアミノアルキルはアミノ部分を含むアルキル基を表す）；

または

(g)

【化 1 5 0】

アルキル N(○アルキルまたは○アリール)-CH(OH)-CH(OH)-CH(OH)-CH2-O-



である、前記化合物。

【請求項 2】

B が CH₂OH である、請求項 1 に記載の化合物。

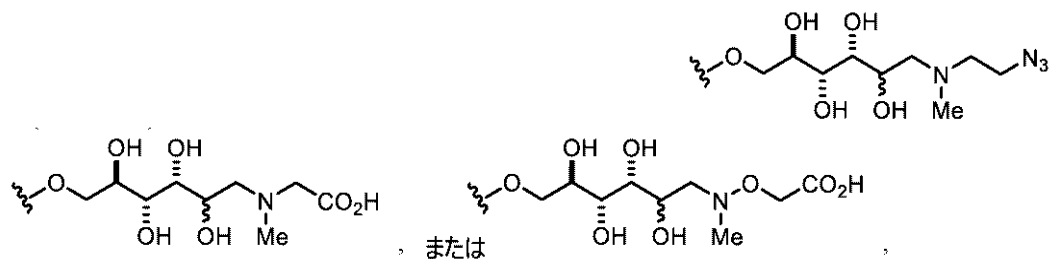
【請求項 3】

A 基が OR であり、R が場合によって置換されたアルキル、アリール、またはヘテロ脂肪族である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

A 基が $-O(CH_2CH_2O)_aCH_2CH_2Cl$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_aCH_2CH_2CO_2H$ 、 $-S(CH_2CH_2O)_aCH_2CH_2Cl$ 、 $-S(CH_2CH_2O)_aCH_2CH_2N_3$ 、 $-S(CH_2CH_2O)_aCH_2CH_2CO_2H$ 、 $-OCH_3$ 、 $-SCH_2CH_3$ 、 $-SC_6H_5$ 、

【化 2 0 1】

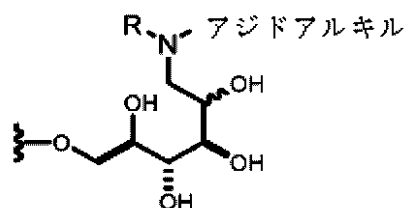


であり、a の各々の例は、独立して 0、1、2、3、4、または 5 である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

A 基が

【化 1 5 3】

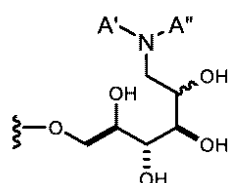


であり、式中、R は、H である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

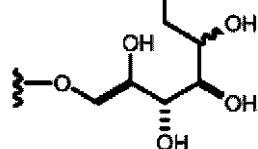
A 基が

【化 1 5 4】



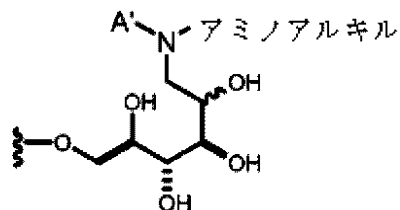
【化 1 5 5】

アルキルまたはアリール N-カルボキシアリール



または

【化 1 5 6】

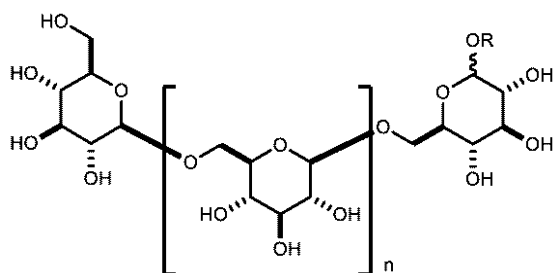


である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 7】

前記化合物が式 (I a)

【化 1 5 9】



(Ia)

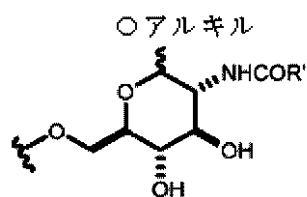
の構造を有し、

式中、

n は 1 ~ 18 の整数であり、

 - OR 基は、 O - アルキル、 O - アルケニル、 O - アルキニル、 O - アリール、 O - ヘテロアリール、

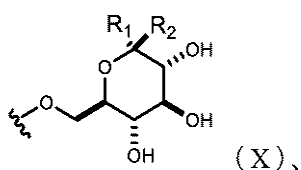
【化 1 6 0】



(W)

または

【化 1 6 1】



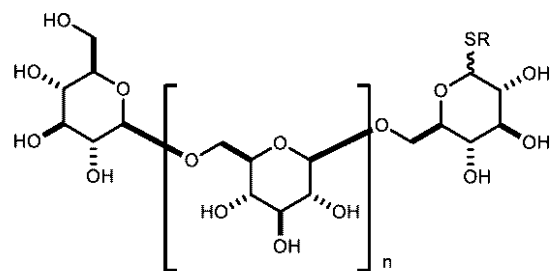
(X)、

から選択され、前記 - OR 基における任意のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリールまたはヘテロアリールは場合によって置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記化合物が式 (I b)

【化 1 6 2】



(Ib)

の構造を有し、式中、

n は 1 ~ 18 の整数であり、

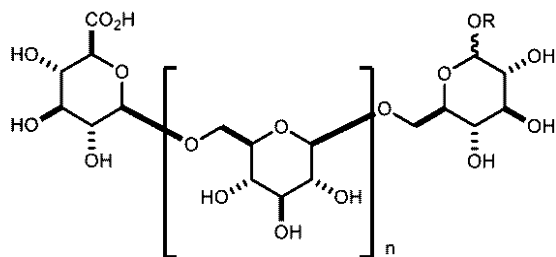
 R は、 アルキル、 アルケニル、 アルキニル、 アリール、及び ヘテロアリールから選択さ

れ、R は場合によって置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

前記化合物が式 (Ic)

【化 163】



(Ic)

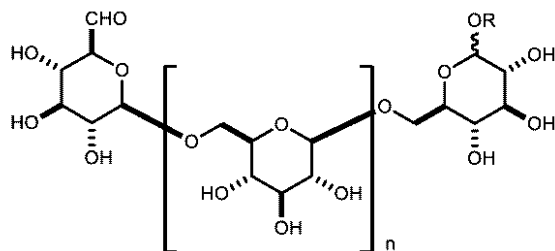
(式中、n は 1 ~ 18 の整数であり、
R は場合によって置換されたアルキルである)

の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

前記化合物が式 (Id)

【化 164】



(Id)

の構造を有し、式中、n は 1 ~ 18 の整数であり、
R は場合によって置換されたアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

A、OR、またはSR基が 型である、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

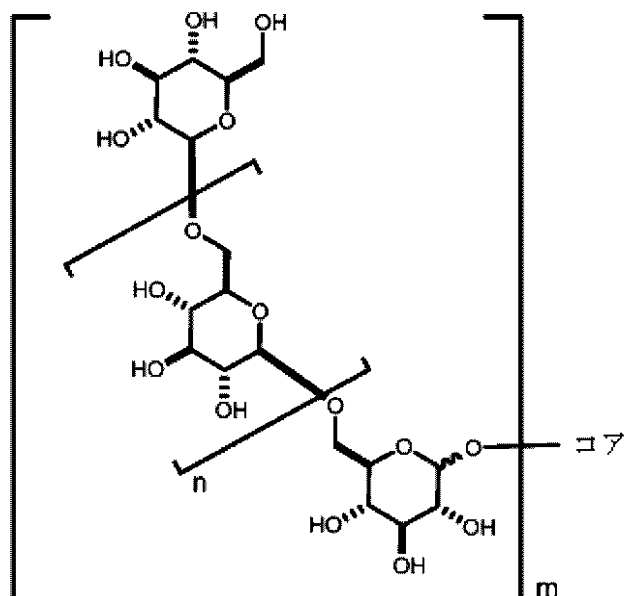
【請求項 12】

A、OR、またはSR基が 型である、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 13】

式 (Ie)

【化 1 6 5】



(Ie)-1

の繰り返し単位によって記載される 2 つ以上の α - 1 , 6 - D - グルカン部分を含み、式中、

前記グルカン部分が、グリコシド結合によって置換アルキル、置換アリールまたは置換ヘテロアリール共通コアに結合し；

n が 1 ～ 18 の整数であり；そして

m が 2 ～ 6 の整数である、式 (I e) の化合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0191

【補正方法】変更

【補正の内容】

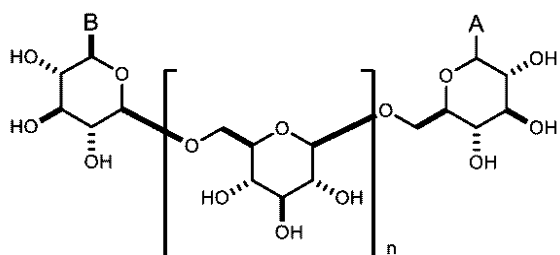
【0191】

我々は本発明の多くの実施形態を記載したが、我々の基本的な実施例を変更して、本発明の化合物及び方法を利用する他の実施形態を提供できることは明らかである。したがって、本発明の範囲は、例として示される特定の実施形態によってよりも添付の特許請求の範囲によって定義されると理解される。 本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

以下の一般式 (I)

【化 1 4 4】



(I)

の構造を有する化合物であって、式中、

n は 1 ～ 18 の整数であり；

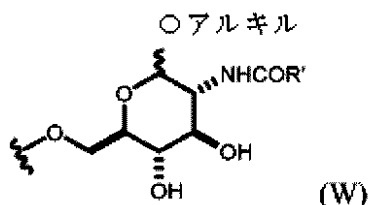
Bは CH_2OH 、 CHO 、または CO_2H であり；

Aは、

(a) OR または SR (R は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレニル、アルケニレン、アルキニレン、アリール、ヘテロアリール、またはヘテロ脂肪族である)；

(b) 6 - O - 置換 - D - グルコサミン (W)

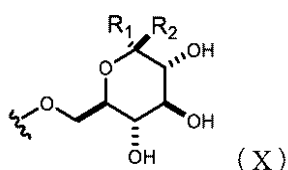
【化 1 4 5】



(式中、 R' は、アルキル、アリール、もしくはヘテロアリールである)；

(c) 6 - O - 置換 - C - グリコシド (X)

【化 1 4 6】



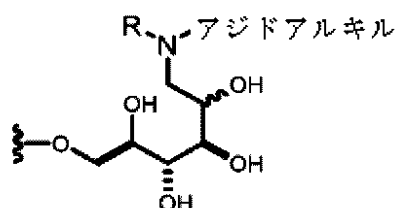
(式中、 R_1 はHであり；そして R_2 はアルケニル、アルキニル、もしくはヘテロ脂肪族である；または

R_2 はHであり；そして R_1 はアルケニル、アルキニル、もしくはヘテロ脂肪族である；そして

aは、0、1、2、3、4、または5である)；

(d)

【化 1 4 7】



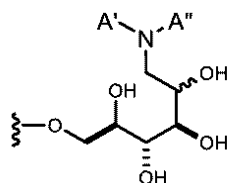
(式中、

R は、H、アルキル、またはアリールであり、そして

アジドアルキルは、アジド部分を含むアルキル基である)；

(e)

【化 1 4 8】



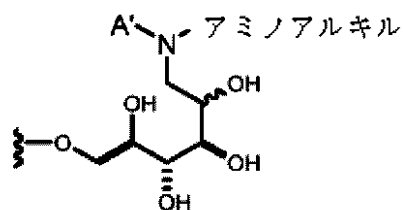
(式中、

A' はアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり； A'' はカルボキシアルキル、カルボキシアリール、またはカルボキシヘテロアリールであり；カルボキシアルキルは脂肪族アミノ酸から形成される残基を表し；カルボキシアリールは芳香族アミノ酸から形成される残基を表し；そしてカルボキシヘテロアリールはヘテロ芳香族アミノ酸から形成

される残基を表す) ;

(f)

【化 1 4 9】



(式中、

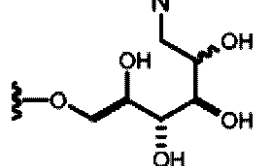
A' はアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり ; そしてアミノアルキルはアミノ部分を含むアルキル基を表す) ;

または

(g)

【化 1 5 0】

アルキル N-アルキルまたはN-アリール



である、前記化合物。

(項目 2)

B が CH_2OH である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3)

B が CHO である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 4)

B が CO_2H である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 5)

n が 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、または 18 である、項目 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物。

(項目 6)

n が、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、または 18 である、項目 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物。

(項目 7)

A が である、項目 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物。

(項目 8)

A が である、項目 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物。

(項目 9)

A 基が OR または SR であり、R がアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、またはヘテロ脂肪族である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 10)

A 基が SR である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 11)

A 基が OR である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 12)

R がアルキル、アルケニル、またはアルキニルである、項目 10 または 11 に記載の化合物。

(項目 13)

R がアリールまたはヘテロアリールである、項目 10 または 11 に記載の化合物。

(項目 14)

R がヘテロ脂肪族である、項目 10 または 11 に記載の化合物。

(項目 15)

R がヘテロアルキルである、項目 14 に記載の化合物。

(項目 16)

R がアルキルである、項目 10 または 11 に記載の化合物。

(項目 17)

R がアリールである、項目 10 または 11 に記載の化合物。

(項目 18)

A 基が OR であり、R がアルキルである、項目 9 に記載の化合物。

(項目 19)

A 基が OR であり、R がアルキル、アリール、またはヘテロ脂肪族である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 20)

A 基が SR であり、R がアルキルである、項目 9 に記載の化合物。

(項目 21)

A 基が OR であり、R がアルキル、アリール、またはヘテロ脂肪族である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 22)

R が置換されていない、項目 9 に記載の化合物。

(項目 23)

R が置換されている、項目 9 に記載の化合物。

(項目 24)

R が、アジド部分、ハロゲン、またはカルボン酸 (CO_2H) 部分である置換基を含む、項目 23 に記載の化合物。

(項目 25)

A 基が $\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_a\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ であり、a が 0、1、2、3、4、または 5 である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 26)

A 基が $\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_a\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}_3$ であり、a が 0、1、2、3、4、または 5 である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 27)

A 基が $\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_a\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ であり、a が 0、1、2、3、4、または 5 である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 28)

A 基が $\text{S}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_a\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ であり、a が 0、1、2、3、4、または 5 である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 29)

A 基が $\text{S}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_a\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}_3$ であり、a が、0、1、2、3、4、または 5 である、項目 9 に記載の化合物。

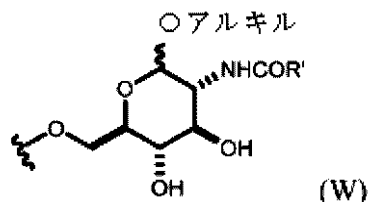
(項目 30)

A 基が $\text{S}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_a\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ であり、a が、0、1、2、3、4、または 5 である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 31)

A 基が 6 - O - 置換 - D - グルコサミン (W)

【化 1 5 1】



である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 3 2)

前記 O アルキル部分が非置換アルキル基を含む、項目 3 1 に記載の化合物。

(項目 3 3)

前記 O アルキル部分が置換アルキル基を含む、項目 3 1 に記載の化合物。

(項目 3 4)

R' が非置換アルキル、アリール、またはヘテロアリール基を含む、項目 3 1 に記載の化合物。

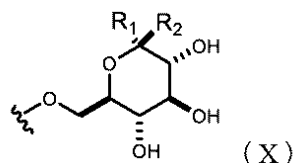
(項目 3 5)

R' が置換アルキル、アリール、またはヘテロアリール基を含む、項目 3 1 に記載の化合物。

(項目 3 6)

A 基が 6 - O - 置換 - C - グリコシド (X)

【化 1 5 2】



である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 3 7)

R₁ または R₂ が非置換アルケニルまたは非置換アルキニル基である、項目 3 6 に記載の化合物。

(項目 3 8)

R₁ または R₂ が置換アルケニルまたは置換アルキニル基である、項目 3 6 に記載の化合物。

(項目 3 9)

R₁ または R₂ が O (CH₂CH₂O)_aCH₂CO₂H である、項目 3 6 に記載の化合物。

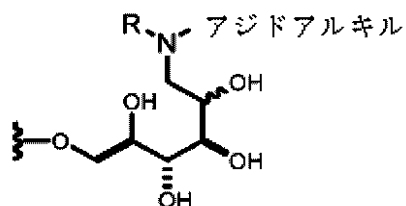
(項目 4 0)

a が、0、1、2、3、4、または 5 である、項目 3 6 に記載の化合物。

(項目 4 1)

A 基が

【化 1 5 3】



であり、式中、R は、H、アルキル、またはアリールであり、そしてアジドアルキルはアジド部分を含むアルキル基である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 4 2)

R が H である、項目 4 1 に記載の化合物。

(項目 4 3)

R が非置換アルキルまたは置換アルキルである、項目 4 1 に記載の化合物。

(項目 4 4)

R が非置換アリールまたは置換アリールである、項目 4 1 に記載の化合物。

(項目 4 5)

前記アジドアルキルがさらなる置換基を含まない、項目 4 1 に記載の化合物。

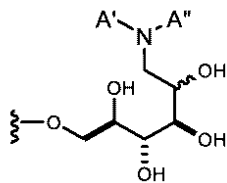
(項目 4 6)

前記アジドアルキルが本明細書中に記載するさらなる置換基を含む、項目 4 1 に記載の化合物。

(項目 4 7)

A 基が

【化 1 5 4】



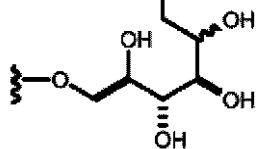
である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 4 8)

A 基が

【化 1 5 5】

アルキルまたはアリール N -カルボキシアリール

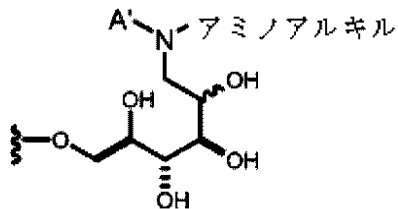


である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 4 9)

A 基が

【化 1 5 6】



である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 5 0)

A 基が非置換または置換アルキル基を含む、項目 4 7 ~ 4 9 のいずれかに記載の化合物。

(項目 5 1)

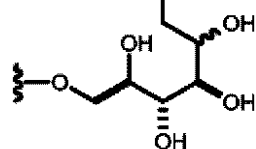
A 基が非置換または置換アリール基を含む、項目 4 7 ~ 4 9 のいずれかに記載の化合物。

(項目 5 2)

A 基が

【化 1 5 7】

アルキル N - O -アルキルまたは O -アリール



である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 5 3)

前記窒素原子に共有結合したアルキルが置換されていない、項目 5 2 に記載の化合物。

(項目 5 4)

前記窒素原子に共有結合したアルキルが置換されている、項目 5 2 に記載の化合物。

(項目 5 5)

前記 O -アルキル部分が非置換アルキル基を含む、項目 5 2 に記載の化合物。

(項目 5 6)

前記 O -アルキル部分が置換アルキル基を含む、項目 5 2 に記載の化合物。

(項目 5 7)

前記 O -アリール部分が非置換アリール基を含む、項目 5 2 に記載の化合物。

(項目 5 8)

前記 O -アリール部分が置換アリール基を含む、項目 5 2 に記載の化合物。

(項目 5 9)

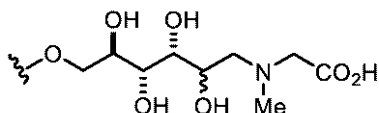
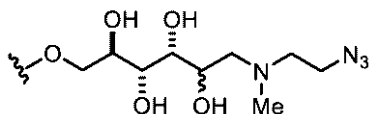
n が、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、または17である、項目 4 1 ~ 5 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 0)

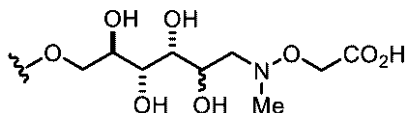
A 基が、 OCH_3 、 SCH_2CH_3 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}_3$ 、 $\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{N}_3$ 、 $\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、または $\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ である、項目 5 2 に記載の化合物。

(項目 6 1)

【化 1 5 8】



または

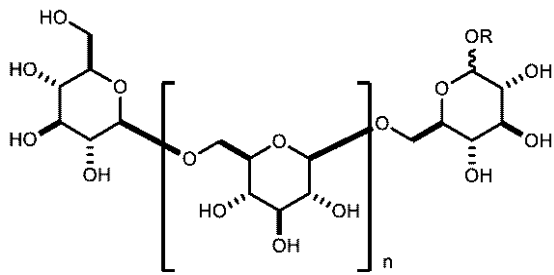


である、項目 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 1)

前記化合物が式 (I a)

【化 1 5 9】



(Ia)

の構造を有し、

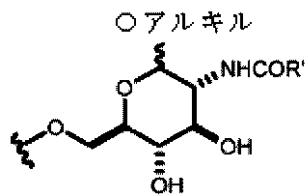
式中、

n は 1 ~ 18 の整数であり、

B は CH_2OH であり、

A 基は OR であり、そして O - アルキル、 $-O$ - アルケニル、 O - アルキニル、 O - アルキレン、 O - アルキニレン、 O - アリール、 O - ヘテロアリール、6 - O - 置換 - D - グルコサミン (W)、

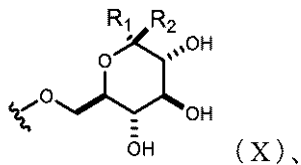
【化 1 6 0】



(W)

または 6 - O - 置換 - C - グリコシド (X)

【化 1 6 1】



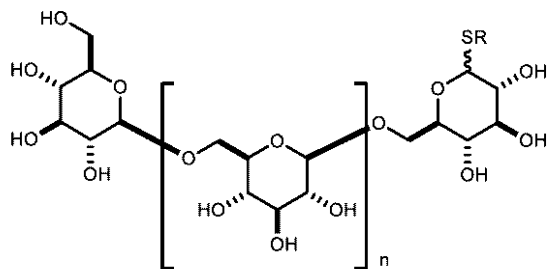
(X)、

を含む群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6 2)

前記化合物が式 (I b)

【化 1 6 2】



(Ib)

の構造を有し、式中、

n は 1 ~ 18 の整数であり、

B は CH_2OH であり、

前記 A 基は S R であり、S - アルキル、- S - アルケニル、S - アルキニル、S - アルキレン、S - アルキニレン、S - アリール、及び S - ヘテロアリールを含む群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6 3)

A 基中のアルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルキニレン、アリール、またはヘテロアリールが置換されていない、項目 6 1 または 6 2 に記載の化合物。

(項目 6 4)

A 基中のアルキル、アルケニル、アルキニル、アルキレン、アルキニレン、アリール、またはヘテロアリールが置換されている、項目 6 1 または 6 2 に記載の化合物。

(項目 6 5)

A 基が 型である、項目 6 1 ~ 6 4 のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 6)

A 基が 型である、項目 6 1 ~ 6 4 のいずれかに記載の化合物。

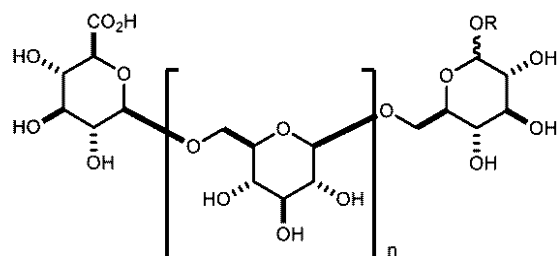
(項目 6 7)

n が、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、または 18 である、項目 6 1 ~ 6 6 のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 8)

前記化合物が式 (I c)

【化 1 6 3】



(Ic)

(式中、n は 1 ~ 18 の整数であり、

A 基は OR であり、OR は O - アルキルであり、そして

B 基は CO₂H である)

の構造を有する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6 9)

A 基が非置換アルキル基を含む、項目 6 8 に記載の化合物。

(項目 7 0)

A 基が置換アルキル基を含む、項目 6 8 に記載の化合物。

(項目 7 1)

A 基が 型である、項目 6 8 ~ 7 0 のいずれかに記載の化合物。

(項目 7 2)

A 基が 型である、項目 6 8 ~ 7 0 のいずれかに記載の化合物。

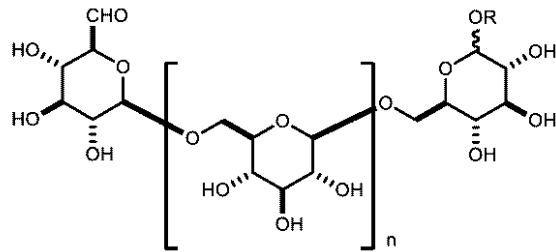
(項目 7 3)

n が、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、または 18 である、項目 6 8 ~ 7 2 のいずれかに記載の化合物。

(項目 7 4)

前記化合物が式 (I d)

【化 1 6 4】



(Id)

の構造を有し、式中、 n は 1 ～ 18 の整数であり、
A 基は、OR であり、OR は O - アルキルであり、そして
B 基は CHO である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 7 5)

A 基が非置換アルキル基を含む、項目 7 4 に記載の化合物。

(項目 7 6)

A 基が置換アルキル基を含む、項目 7 4 に記載の化合物。

(項目 7 7)

A 基が 型である、項目 7 4 ～ 7 6 のいずれかに記載の化合物。

(項目 7 8)

A 基が 型である、項目 7 4 ～ 7 6 のいずれかに記載の化合物。

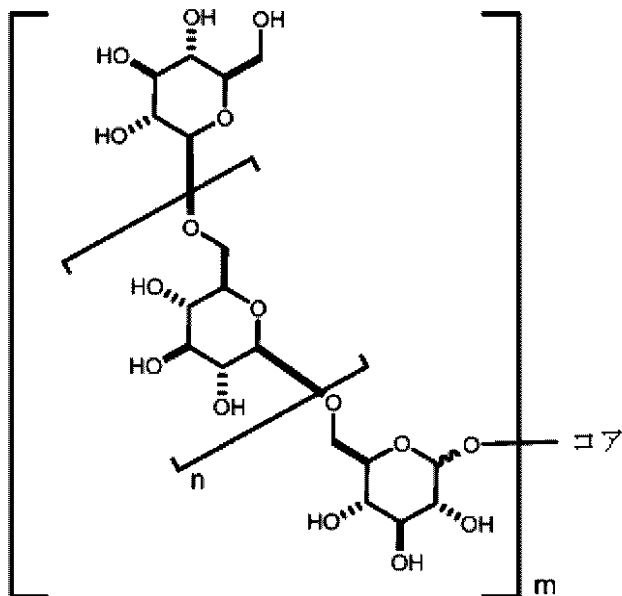
(項目 7 9)

n が、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、
 16、17、または 18 である、項目 7 4 ～ 7 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 8 0)

式 (I e)

【化 1 6 5】



(le)-1

の繰り返し単位によって記載される 2 つ以上の - 1 , 6 - D - グルカン部分を含み、式
 中、

前記グルカン部分が、グリコシド結合によって置換アルキル、置換アリールまたは置換
 ヘテロアリール共通コアに結合し；

n が 1 ～ 18 の整数であり；そして

m が 2 ～ 6 の整数である、式 (I e) の化合物。

(項目 8 1)

n が 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、または 20 である、項目 8 0 に記載の化合物。

(項目 8 2)

m が 2、3、4、5、または 6 である、項目 8 0 または 8 1 に記載の化合物。

(項目 8 3)

前記グリコシド結合が である、項目 8 0 ～ 8 2 のいずれかに記載の化合物。

(項目 8 4)

グリコシド結合が である、項目 8 0 ～ 8 2 のいずれかに記載の化合物。

(項目 8 5)

項目 1 ～ 8 4 のいずれかに記載の化合物を含む組成物。