

【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20年10月16日(2008.10.16)

【公表番号】特表2008-511634(P2008-511634A)

【公表日】平成20年4月17日(2008.4.17)

【年通号数】公開・登録公報2008-015

【出願番号】特願2007-530141(P2007-530141)

【国際特許分類】

C 07 H	15/10	(2006.01)
A 61 K	35/12	(2006.01)
A 61 P	37/02	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	31/00	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 K	31/7028	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	1/16	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	7/00	(2006.01)
A 61 P	17/06	(2006.01)
C 07 H	15/04	(2006.01)
C 07 H	15/18	(2006.01)

【F I】

C 07 H	15/10	
A 61 K	35/12	
A 61 P	37/02	
A 61 P	35/00	
A 61 P	31/00	
A 61 P	3/10	
A 61 K	31/7028	
A 61 P	21/00	
A 61 P	17/00	
A 61 P	37/06	
A 61 P	25/00	
A 61 P	1/16	
A 61 P	29/00	1 0 1
A 61 P	19/02	
A 61 P	13/12	
A 61 P	7/00	
A 61 P	17/06	
C 07 H	15/04	E
C 07 H	15/18	

【手続補正書】

【提出日】平成20年8月26日(2008.8.26)

【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

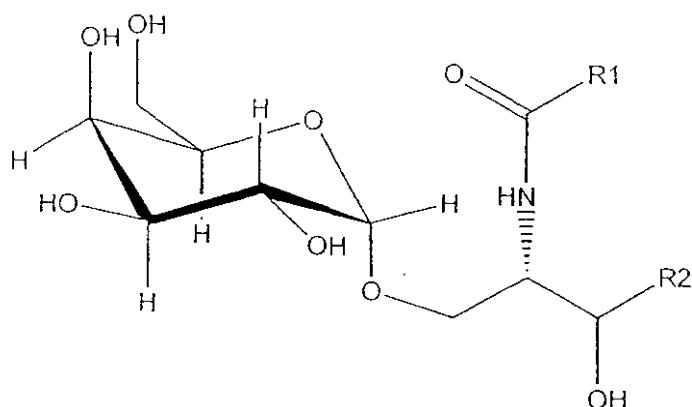
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



式I

[式中、

R1は、少なくとも1個のC=C結合を有する直線状又は分岐したC₁-C₂₇アルケンであるが、-(CH₂)₇CH=CH(CH₂)₇CH₃でなく、又はR1は、C(OH)-R3(ここで、R3は、少なくとも1個のC=C結合を有する直線状又は分岐したC₁-C₂₆アルケンである)であり;そして、

R2は、下記(a)-(e):

- (a)-CH₂(CH₂)_xCH₃;
- (b)-CH(OH)(CH₂)_xCH₃;
- (c)-CH(OH)(CH₂)_xCH(CH₃)₂;
- (d)-CH=CH(CH₂)_xCH₃;
- (e)-CH(OH)(CH₂)_xCH(CH₃)CH₂CH₃

{式中、Xは、5~17の範囲の整数である}

の1つである]

を含む-ガラクトシルセラミド。

【請求項2】

R2が、CH(OH)(CH₂)₁₃CH₃である、請求項1に記載の-ガラクトシルセラミド。

【請求項3】

R1が、(CH₂)₉CH=CH-CH₂-CH=CH(CH₂)₄CH₃、(CH₂)₂CH=CH-CH₂-CH=CH-CH₂-CH=CH-CH₂-CH=CH-(CH₂)₄CH₃、(CH₂)₃CH=CH-CH₂-CH=CH-CH=CH-CH₂-CH=CH-CH₂-CH=CH=CH-CH₂-CH=CH-(CH₂)₃CH₃及び(CH₂)₇CH=CH-CH₂-CH₂-CH=CH=CH=CH-CH₂-CH=CH₂から成る群から選択される、請求項1又は2に記載の-ガラクトシルセラミド。

【請求項 4】

二重結合がシスである、請求項 3 に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 5】

R₂ が、 $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_{13}\text{CH}_3$ である、請求項 3 に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 6】

- ガラクトシルセラミドの濃度が、同濃度の KRN7000 によって誘導される NK T 細胞によるサイトカイン産生に等しいか又はそれより大きいレベルで、該産生を誘導することができる、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 7】

サイトカインが、 IL-2、 IL-4 及び IFN から成る群から選択される、請求項 6 に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 8】

サイトカインが、リンパ球抗原提示細胞、骨髄細胞系列の樹状抗原提示細胞、又は上皮抗原提示細胞を用いて誘導される、請求項 6 に記載の - ガラクトシルセラミド。

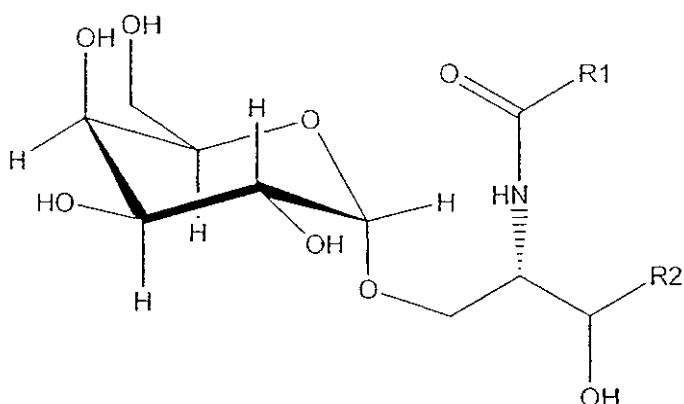
【請求項 9】

- ガラクトシルセラミドの濃度が、同濃度の KRN7000 によって誘導される NK T 細胞による CD40L 発現に等しいか又はそれより大きいレベルで、該発現を誘導することができる、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 10】

式 I :

【化 2】



式 I

[式中、

R₁ は、分岐した C₁ - C₂₇ アルカンであり、又は

R₁ は、 $\text{C}(\text{OH})-\text{R}_3$ (ここで、 R₃ は、直線状又は分岐した C₁ - C₂₆ アルケンである) であり；そして、

R₂ は、下記 (a) - (e) :

(a) - $\text{CH}_2(\text{CH}_2)_x\text{CH}_3$;

(b) - $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_x\text{CH}_3$;

(c) - $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_x\text{CH}(\text{CH}_3)_2$;

(d) - $\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_x\text{CH}_3$;

(e) - $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_x\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$

{ 式中、 X は、 5 ~ 17 の範囲の整数である }

の 1 つである]

を含む - ガラクトシルセラミド。

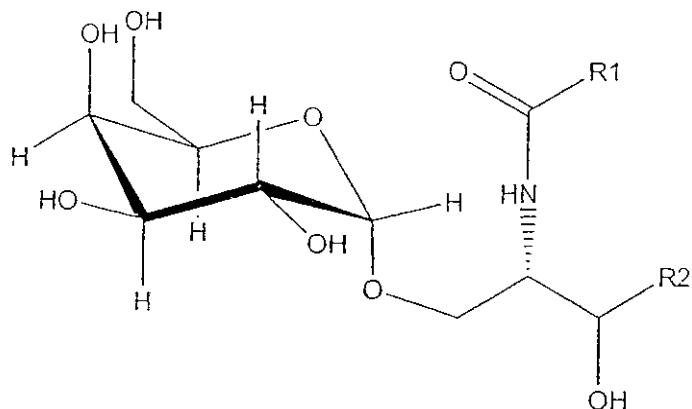
【請求項 1 1】

R 2 が、 $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_{13}\text{CH}_3$ である、 請求項 1 0 に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 1 2】

式 I :

【化 3】



式 I

[式中、

R 1 は、 $\text{C}_6 - \text{C}_{27}$ アルカン又はアルケン（ここで、（i） $\text{C}_6 - \text{C}_{27}$ アルカン又はアルケンは、 $\text{C}_5 - \text{C}_{15}$ シクロアルカン、 $\text{C}_5 - \text{C}_{15}$ シクロアルケン、ヘテロ環又は芳香族環で置換され、あるいは（ii） $\text{C}_6 - \text{C}_{27}$ アルカン又はアルケンは、 $\text{C}_6 - \text{C}_{27}$ アルキル又はアルケニル鎖内に、 $\text{C}_5 - \text{C}_{15}$ シクロアルカン、 $\text{C}_5 - \text{C}_{15}$ シクロアルケン、ヘテロ環又は芳香族環を含む）であり；そして、

R 2 は、下記（a）-（e）：

- (a) - $\text{CH}_2(\text{CH}_2)_x\text{CH}_3$ ；
- (b) - $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_x\text{CH}_3$ ；
- (c) - $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_x\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ；
- (d) - $\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_x\text{CH}_3$ ；
- (e) - $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_x\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$

{ 式中、X は、5 ~ 17 の範囲の整数である }

の 1 つである]

を含む - ガラクトシルセラミド。

【請求項 1 3】

R 2 が、 $\text{CH}(\text{OH})(\text{CH}_2)_{13}\text{CH}_3$ である、 請求項 1 2 に記載の - ガラクトシルセラミド。

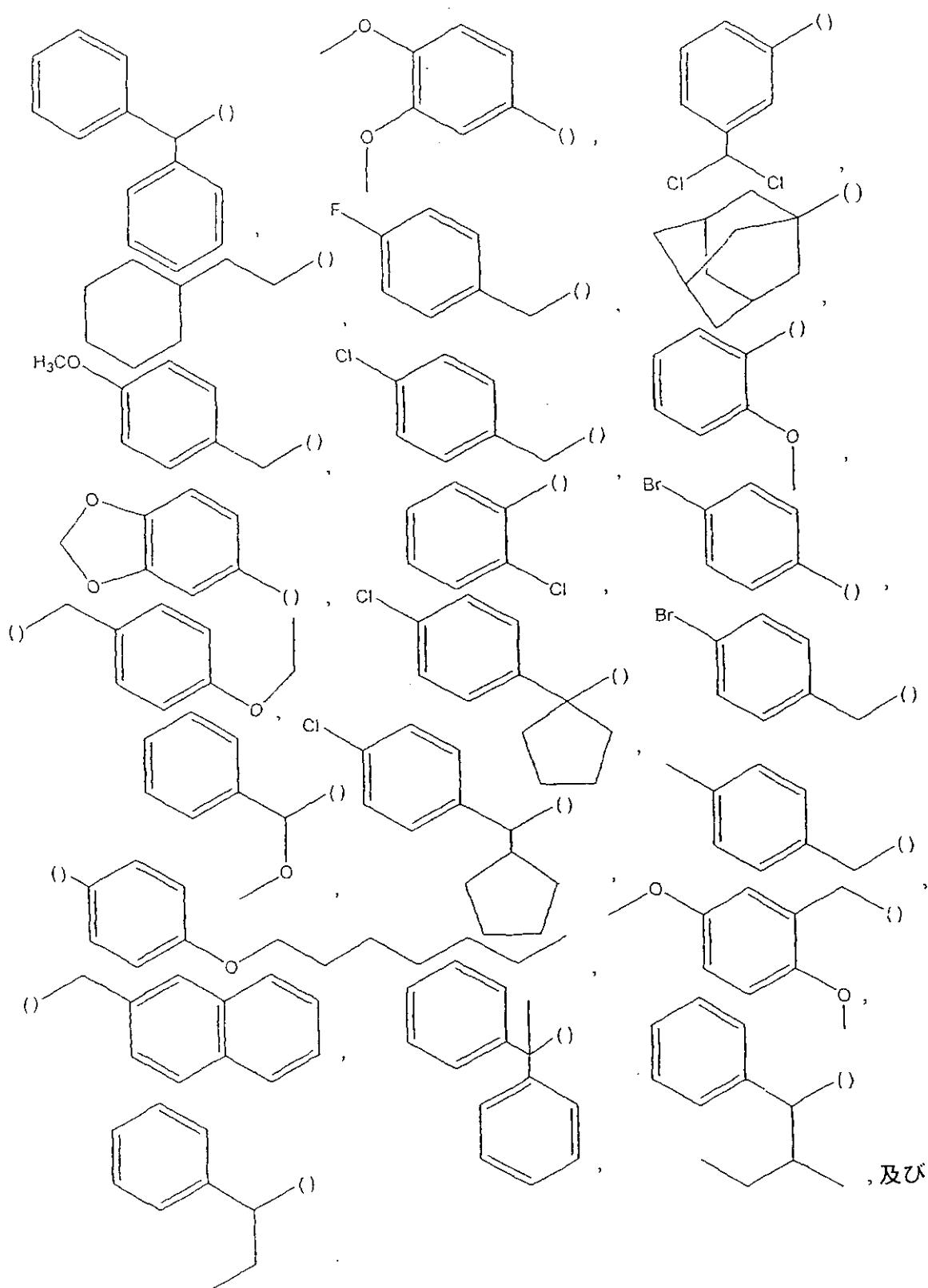
【請求項 1 4】

R 1 が、オキソ；ヒドロキシ；ハロゲン；-OC(O)R₅；-OR₅；-C(O)R₅；又はN(R₅)₂（ここで、各R₅は、独立して、水素、C₁-C₆アルキル、又は場合によりハロゲン、ヒドロキシ、ハロゲン、-OC(O)R₆、-OR₆、-C(O)R₆、N(R₆)₂で置換された芳香族環であり；各R₆は、独立して、水素又はC₁-C₆アルキルである）で置換される、 請求項 1 2 又は 1 3 に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 1 5】

R 1 は、下記：

【化 4】



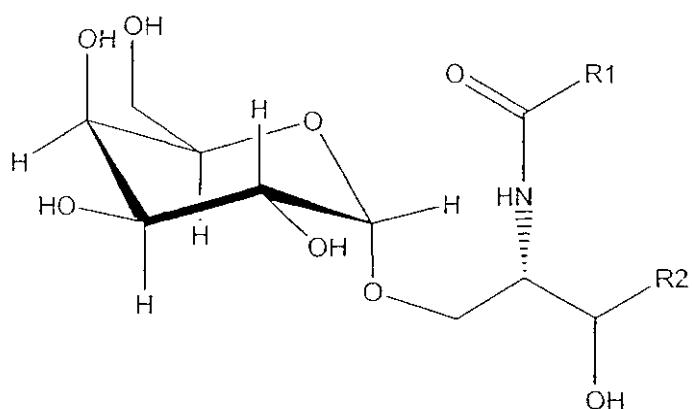
{式中、()は、式Iの化合物に対するR1の結合点を表す}

から成る群から選択される、請求項12又は13に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項16】

式I：

【化5】



式 I

[式中、

R1は、-C(=O)OC₂CH₃、-(CH₂)₆CH₃、-(CH₂)₄Cl、-(CH₂)₁₆CH₃、-(CH₂)₅CH₃、-(CH₂)₂CH₃、-(CH₂)₄CH₃、-(CH₂)₈CH₃、-C(CH₂)₁₀CH₃、-C(CH₂)₁₂CH₃から成る群から選択され；そして、

R2は、下記(a)-(e)：

- (a) -CH₂(CH₂)_xCH₃；
- (b) -CH(OH)(CH₂)_xCH₃；
- (c) -CH(OH)(CH₂)_xCH(CH₃)₂；
- (d) -CH=CH(CH₂)_xCH₃；
- (e) -CH(OH)(CH₂)_xCH(CH₃)CH₂CH₃

{式中、Xは、5～17の範囲の整数である}

の1つである]

を含む-ガラクトシルセラミド。

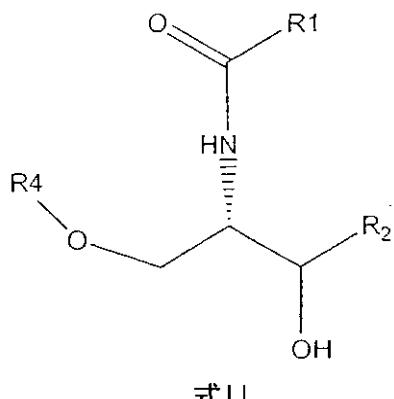
【請求項17】

R2が、CH(OH)(CH₂)₁₃CH₃である、請求項16に記載の-ガラクトシルセラミド。

【請求項18】

式II：

【化6】



[式中、

R1は、直線状若しくは分岐したC₁-C₂₇アルカン又はアルケンであり、又は、

R1は、C(OH)-R3（ここで、R3は、少なくとも1個のC=C結合を有する直線状若しくは分岐したC₁-C₂₆アルケンである）であり、

あるいは、R1は、C₆-C₂₇アルカン又はアルケン（ここで、（i）C₆-C₂₇アルカン又はアルケンは、C₅-C₁₅シクロアルカン、C₅-C₁₅シクロアルケン、ヘテロ環又は芳香族環で置換され、あるいは（ii）C₆-C₂₇アルカン又はアルケンは、C₆-C₂₇アルキル又はアルケニル鎖内に、C₅-C₁₅シクロアルカン、C₅-C₁₅シクロアルケン、ヘテロ環又は芳香族環を含む）であり；

R2は、下記(a)-(e)：

(a)-CH₂(CH₂)_xCH₃；

(b)-CH(OH)(CH₂)_xCH₃；

(c)-CH(OH)(CH₂)_xCH(CH₃)₂；

(d)-CH=CH(CH₂)_xCH₃；

(e)-CH(OH)(CH₂)_xCH(CH₃)CH₂CH₃

{式中、Xは、5~17の範囲の整数である}

の1つであり；

R4は、-ガラクトシリル及び結合の单糖以外の結合の单糖である]を含むグリコシリルセラミド。

【請求項19】

R1が、(CH₂)₂₂-CH₃である、請求項18に記載のグリコシリルセラミド。

【請求項20】

R2が、CH(OH)-(CH₂)₁₃-CH₃である、請求項18又は19に記載のグリコシリルセラミド。

【請求項21】

R4が、-ガラクトシリル以外の結合の单糖である、請求項18~20のいずれか1項に記載のグリコシリルセラミド。

【請求項22】

R4が、フコース及びグルコースから成る群から選択される、請求項21に記載のグリコシリルセラミド。

【請求項23】

R4が、結合の单糖である、請求項18~20のいずれか1項に記載のグリコシリルセラミド。

【請求項24】

R 4 が、 - マンノシルである、請求項 2 3 に記載のグリコシルセラミド。

【請求項 2 5】

請求項 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の - ガラクトシルセラミド又はグリコシルセラミド、及び医薬として許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 2 6】

樹状細胞をさらに含む、請求項 2 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

哺乳動物における自己免疫疾患、癌又は感染症を治療又は予防するための請求項 2 5 又は 2 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

自己免疫疾患が、I 型糖尿病、重症筋無力症、尋常性天疱瘡、全身性紅斑性狼瘡、ギラン・バレー症候群、抗リン脂質症候群、グッドパスチャー症候群、移植片対宿主疾患、多発性硬化症、原発性胆汁性肝硬変、強皮症、脈管炎、白斑、ウェグナー肉芽腫症、関節リウマチ、糸球体腎炎、特発性血小板減少性紫斑病、乾癬、及びシェーグレン病から成る群から選択される、請求項 2 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

式 I の化合物が IL - 4 及び IFN の産生を誘導し、IFN に対する IL - 4 の比が同量の KRN - 7000 によって誘導される IFN に対する IL - 4 の比よりも大きく、該 IL - 4 と IFN の産生がインビトロ又はインビボアッセイによって測定される、請求項 1 に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 3 0】

IL - 4 と IFN の産生がインビトロの脾臓細胞アッセイによって測定される、請求項 2 9 に記載の - ガラクトシルセラミド。

【請求項 3 1】

サイトカインアッセイが、RMA - s . mCD1d 細胞株、JAWS II 細胞株、及び HeLa . hCD1d 細胞株から成る群から選択される抗原提示細胞株を用いて、NK T ハイブリドーマ DN32 . D3 による IL - 2 産生を測定することによって測定される、請求項 6 に記載の - ガラクトシルセラミド。