

【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5年7月3日(2023.7.3)

【国際公開番号】WO2020/257870
 【公表番号】特表2022-539091(P2022-539091A)
 【公表日】令和4年9月7日(2022.9.7)
 【年通号数】公開公報(特許)2022-165
 【出願番号】特願2021-577007(P2021-577007)
 【国際特許分類】

10

C 0 7 K 5/06(2006.01)
 A 6 1 K 38/07(2006.01)
 A 6 1 P 11/00(2006.01)
 A 6 1 P 31/00(2006.01)
 A 6 1 P 31/12(2006.01)
 A 6 1 P 31/04(2006.01)
 A 6 1 P 43/00(2006.01)
 C 0 7 K 5/02(2006.01)
 C 1 2 Q 1/02(2006.01)

【F I】

20

C 0 7 K 5/06
 A 6 1 K 38/07 Z N A
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 31/00
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 K 5/02
 C 1 2 Q 1/02

30

【手続補正書】
 【提出日】令和5年6月23日(2023.6.23)

【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】

構造：

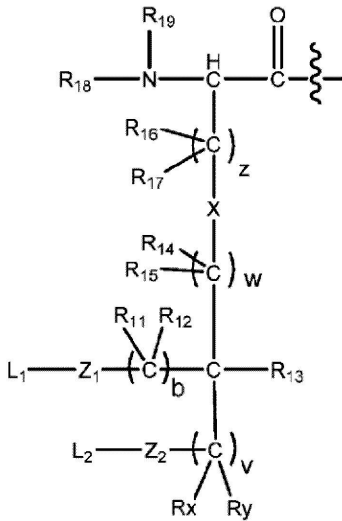
40

A - Y - B

(式中、Aが、

50

【化 1】



10

によって表され、

式中、

b 及び w がそれぞれ、独立して、0 ~ 7 の整数であり、v が、0 ~ 5 の整数であり、ただし：

20

b、v、及び w の和が、少なくとも 3 であり；

b 及び w の和が、0 ~ 7 であり；

z が、1 又は 2 であり；

X が、- S -、- S (= O) - 及び - S (= O)₂ - から選択され；

Z₁ 及び Z₂ がそれぞれ、独立して、- O -、- NR -、- S -、S (= O)、S (= O)₂ -、- C (= O) O -、- OC (= O) -、- C (= O) NR -、- NRC (= O) -、- C (= O) S -、- SC (= O) -、OC (= O) O -、NRC (= O) O -、- OC (= O) NR -、及び - NRC (= O) NR - からなる群から選択され；

R₁₁、R₁₂、R_x、R_y、R₁₄、R₁₅、R₁₆、及び R₁₇ がそれぞれ、独立して、H 又は C₁ ~ C₆ 脂肪族であり；

30

R、R₁₃ 及び R₁₈ がそれぞれ、独立して、H 又は C₁ ~ C₆ 脂肪族であり；

R₁₉ が、H、C₁ ~ C₆ 脂肪族、アミノ保護基、L₃ - C (= O) -、又は A₂ であり；

L₁ 及び L₂ がそれぞれ、独立して、C₅ ~ C₂₁ 脂肪族又は C₄ ~ C₂₀ ヘテロ脂肪族であり；

L₃ が、C₁ ~ C₂₁ 脂肪族又は C₂ ~ C₂₀ ヘテロ脂肪族であり；

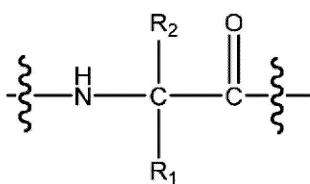
A₂ が、アミノ酸又はペプチドであり；

ここで、R、R₁₁、R₁₂、R₁₃、R₁₄、R₁₅、R₁₆、R₁₇、R₁₈、R₁₉、R_x、R_y、L₁、L₂、及び L₃ のいずれかに存在するいずれかの脂肪族又はヘテロ脂肪族が、任意に置換され；

40

Y が、

【化 2】



であり、

式中、R₁ 及び R₂ が、独立して、H、- CH₂OH、- CH₂CH₂OH、- CH (

50

$\text{CH}_3\text{)OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{OPO}(\text{OH})_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 及び $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{OR}_8$ からなる群から選択され、ここで、前記アルキル水素のいずれか 1 つが、ハロゲンで置換され得；

R_8 が、 H 及び直鎖状又は分枝鎖状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルからなる群から選択され；

B が、ポリエチレングリコール (PEG) を表す)

を含む化合物、

又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 2】

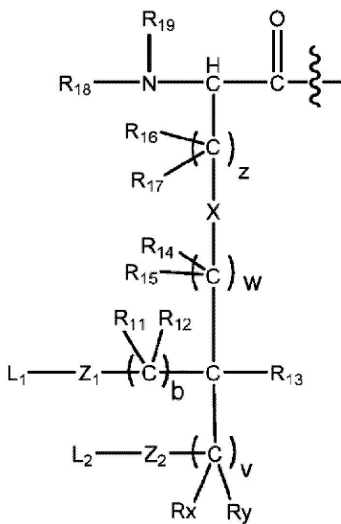
A 及び PEG を含む化合物であって、前記 A 及び PEG が、グリシン、セリン、ホモセリン、トレオニン、ホスホセリン、アスパラギン若しくはグルタミン残基、又はグルタミン残基のエステルによって結合され、

10

ここで、

前記化合物中の A が、構造：

【化 3】



20

を有し、

30

式中、

b 及び w がそれぞれ、独立して、 $0 \sim 7$ の整数であり、 v が、 $0 \sim 5$ の整数、例えば $2 \sim 5$ であり、ただし：

b 、 v 、及び w の和が、少なくとも 3 であり；

b 及び w の和が、 $0 \sim 7$ であり；

z が、 1 又は 2 であり；

X が、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})-$ 及び $-\text{S}(=\text{O})_2-$ から選択され；

Z_1 及び Z_2 がそれぞれ、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})-$ 、 $\text{S}(=\text{O})_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}-$ 、 $-\text{NRC}(=\text{O})-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{S}-$ 、 $-\text{SC}(=\text{O})-$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $\text{NRC}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}-$ 、及び $-\text{NRC}(=\text{O})\text{NR}-$ からなる群から選択され；

40

b 、 v 、 w 、及び z の各場合における R_{11} 、 R_{12} 、 R_x 、 R_y 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、及び R_{17} がそれぞれ、独立して、 H 又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 脂肪族であり；

R 、 R_{13} 及び R_{18} がそれぞれ、独立して、 H 又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 脂肪族であり；

R_{19} が、 H 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 脂肪族、アミノ保護基、 $\text{L}_3-\text{C}(=\text{O})-$ 、又は A_2 であり；

L_1 及び L_2 がそれぞれ、独立して、 $\text{C}_5 \sim \text{C}_{21}$ 脂肪族又は $\text{C}_4 \sim \text{C}_{20}$ ヘテロ脂肪族であり；

L_3 が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{21}$ 脂肪族又は $\text{C}_2 \sim \text{C}_{20}$ ヘテロ脂肪族であり；

A_2 が、アミノ酸又はペプチドであり；

50

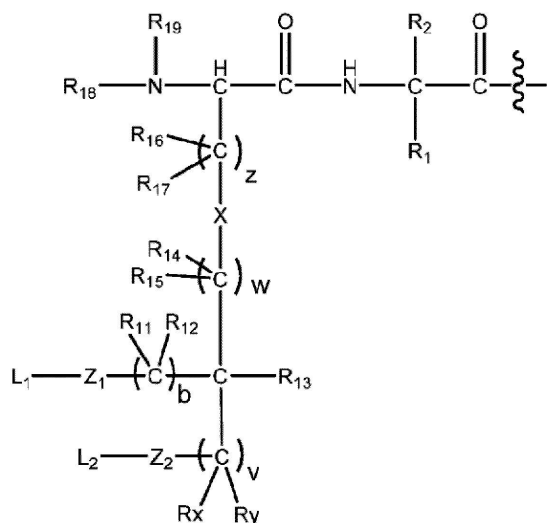
ここで、 R 、 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、 R_{18} 、 R_{19} 、 R_x 、 R_y 、 L_1 、 L_2 、及び L_3 のいずれかに存在するいずれかの脂肪族又はヘテロ脂肪族が、任意に置換される、化合物；

又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項3】

下式：

【化4】



10

20

(式中、 R_1 及び R_2 が、独立して、 H 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH(CH_3)OH$ 、 $-CH_2OPO(OH)_2$ 、 $-CH_2C(=O)NH_2$ 、 $-CH_2CH_2C(=O)OH$ 及び $-CH_2CH_2C(=O)OR_8$ からなる群から選択され、ここで、前記アルキル水素のいずれか1つが、ハロゲンで置換され得；

R_8 が、 H 及び直鎖状又は分枝鎖状 $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され；

b 及び w がそれぞれ、独立して、 $0 \sim 7$ の整数であり、 v が、 $0 \sim 5$ の整数であり、ただし：

b 、 v 、及び w の和が、少なくとも3であり；

30

b 及び w の和が、 $0 \sim 7$ であり；

z が、1又は2であり；

X が、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 及び $-S(=O)_2-$ から選択され；

Z_1 及び Z_2 がそれぞれ、独立して、 $-O-$ 、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-C(=O)NR-$ 、 $-NRC(=O)-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-SC(=O)-$ 、 $-OC(=O)O-$ 、 $-NRC(=O)O-$ 、 $-OC(=O)NR-$ 、及び $-NRC(=O)NR-$ からなる群から選択され；

b 、 v 、 w 、及び z の各場合における R_{11} 、 R_{12} 、 R_x 、 R_y 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、及び R_{17} がそれぞれ、独立して、 H 又は $C_1 \sim C_6$ 脂肪族であり；

40

R 、 R_{13} 及び R_{18} がそれぞれ、独立して、 H 又は $C_1 \sim C_6$ 脂肪族であり；

R_{19} が、 H 、 $C_1 \sim C_6$ 脂肪族、アミノ保護基、 $L_3-C(=O)-$ 、又は A_2 であり；

L_1 及び L_2 がそれぞれ、独立して、 $C_5 \sim C_{21}$ 脂肪族又は $C_4 \sim C_{20}$ ヘテロ脂肪族であり；

L_3 が、 $C_1 \sim C_{21}$ 脂肪族又は $C_2 \sim C_{20}$ ヘテロ脂肪族であり；

A_2 が、アミノ酸又はペプチドであり；

ここで、 R 、 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、 R_{18} 、 R_{19} 、 R_x 、 R_y 、 L_1 、 L_2 、及び L_3 のいずれかに存在するいずれかの脂肪族又はヘテロ脂肪族が、任意に置換される)

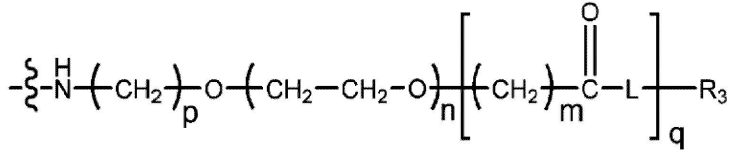
50

を含む化合物であって；
 ポリエチレングリコール（PEG）に共有結合された化合物、
 又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 4】

前記 PEG が、下式：

【化 5】



10

で表される置換 PEG であり、
 式中、

n が、3 ~ 100 であり；

m が、1、2、3 又は 4 であり；

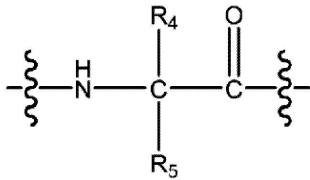
p が、2、3 又は 4 であり；

q が、ゼロ又は 1 であり；

R₃ が、H、-NH₂ 又は -OH であり、q がゼロである場合、R₃ は H であり、q が 1 である場合、R₃ は、-NH₂ 又は -OH であり；

L は、ゼロであるか、又は 1 ~ 10 個の単位からなり、ここで、各単位は、天然アミノ酸であるか、又は天然アミノ酸に由来し、式：

【化 6】

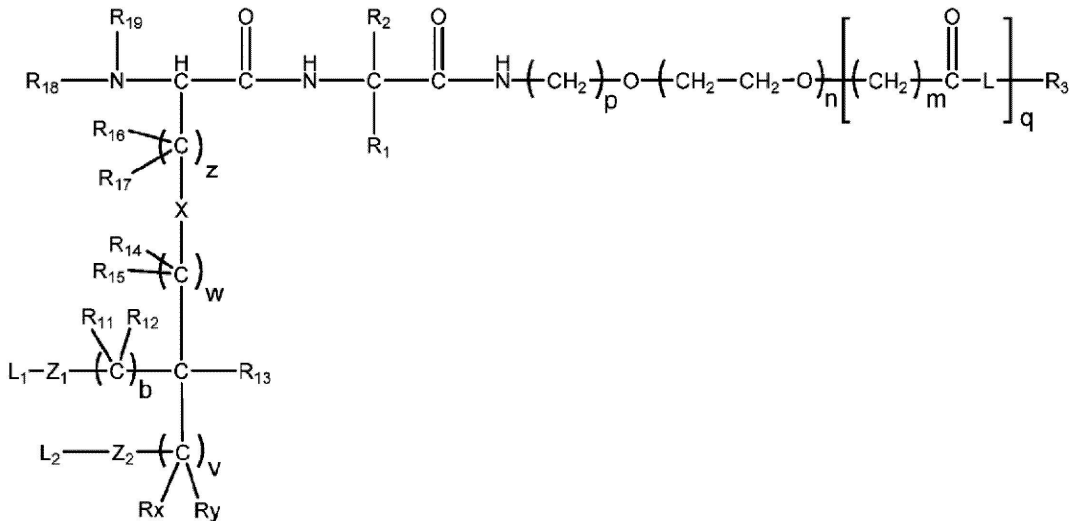


で表され、

式中、R₄ が H であり；

R₅ が、前記アミノ酸の側鎖又は第 2 水素であり、
 好ましくは前記化合物が、式 (VI)；

【化 7】



40

(VI)

50

(式中、

n が、3～100であり；

m が、1、2、3又は4であり；

p が、2、3又は4であり；

q が、ゼロ又は1であり；

R_1 及び R_2 が、独立して、 H 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH(CH_3)OH$ 、 $-CH_2OPO(OH)_2$ 、 $-CH_2C(=O)NH_2$ 、 $-CH_2CH_2C(=O)OH$ 及び $CH_2CH_2C(=O)OR_8$ からなる群から選択され、ここで、前記アルキル水素のいずれか1つが、ハロゲンで置換され得；

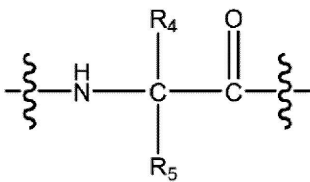
R_8 が、 H 及び直鎖状又は分枝鎖状 $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群から選択され；

$q = 1$ である場合、 R_3 は、 $-NH_2$ 又は $-OH$ であり；

$q = 0$ である場合、 R_3 は H であり；

L は、ゼロであるか、又は1～10個の単位からなり、ここで、各単位は、天然アミノ酸であるか、又は天然アミノ酸に由来し、式：

【化8】



で表され、

式中、 R_4 が H であり；

R_5 が、前記アミノ酸の側鎖又は第2水素であり；

b 及び w がそれぞれ、独立して、0～7の整数であり、 v が、0～5の整数であり、ただし；

b 、 v 、及び w の和が、少なくとも3であり；

b 及び w の和が、0～7であり；

z が、1又は2であり；

X が、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 及び $-S(=O)_2-$ から選択され；

Z_1 及び Z_2 がそれぞれ、独立して、 $-O-$ 、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-C(=O)NR-$ 、 $-NRC(=O)-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-SC(=O)-$ 、 $-OC(=O)O-$ 、 $-NRC(=O)O-$ 、 $-OC(=O)NR-$ 、及び $-NRC(=O)NR-$ からなる群から選択され；

b 、 v 、 w 、及び z の各場合における R_{11} 、 R_{12} 、 R_x 、 R_y 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、及び R_{17} がそれぞれ、独立して、 H 又は $C_1 \sim C_6$ 脂肪族であり；

R 、 R_{13} 及び R_{18} がそれぞれ、独立して、 H 又は $C_1 \sim C_6$ 脂肪族であり；

R_{19} が、 H 、 $C_1 \sim C_6$ 脂肪族、アミノ保護基、 $L_3-C(=O)-$ 、又は A_2 であり；

L_1 及び L_2 がそれぞれ、独立して、 $C_5 \sim C_{21}$ 脂肪族又は $C_4 \sim C_{20}$ ヘテロ脂肪族であり；

L_3 が、 $C_1 \sim C_{21}$ 脂肪族又は $C_2 \sim C_{20}$ ヘテロ脂肪族であり；

A_2 が、アミノ酸又はペプチドであり；

ここで、 R 、 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、 R_{18} 、 R_{19} 、 R_x 、 R_y 、 L_1 、 L_2 、及び L_3 のいずれかに存在するいずれかの脂肪族又はヘテロ脂肪族が、任意に置換される。

又は、

式(VII)：

$A-Y-NH-(CH_2)_p-O-(CH_2-CH_2-O)_n-[(CH_2)_m-CO-$

10

20

30

40

50

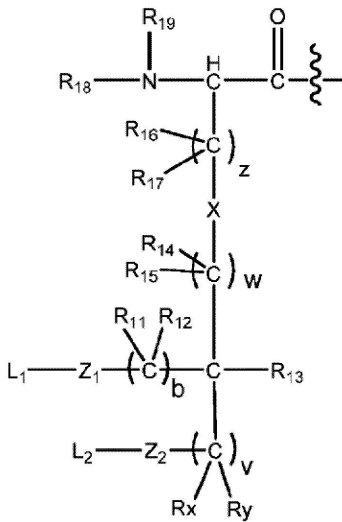
L -]_q R₃

(V I I)

(式中、

A が、構造：

【化 9】



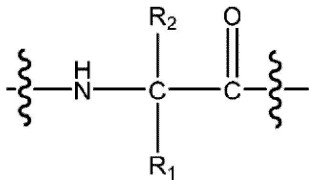
10

20

を有し；

Y が、

【化 1 0】



30

であり、

式中、R₁ 及び R₂ が、独立して、H、-CH₂OH、-CH₂CH₂OH、-CH(CH₃)OH、-CH₂OPO(OH)₂、-CH₂C(=O)NH₂、-CH₂CH₂C(=O)OH 及び -CH₂CH₂C(=O)OR₈ からなる群から選択され、ここで、前記アルキル水素のいずれか 1 つが、ハロゲンで置換され得；

R₈ が、H 及び直鎖状又は分枝鎖状 C₁ ~ C₆ アルキルからなる群から選択され；

n が、3 ~ 100 であり；

m が、1、2、3 又は 4 であり；

p が、2、3 又は 4 であり；

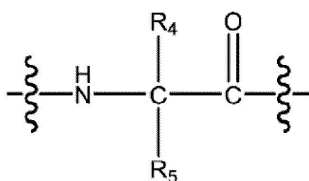
q が、ゼロ又は 1 であり；

q が 1 である場合、R₃ は、-NH₂ 又は -OH であり；

q がゼロである場合、R₃ は H であり；

L は、ゼロであるか、又は 1 ~ 10 個の単位からなり、ここで、各単位は、天然 アミノ酸であるか、又は天然 アミノ酸に由来し、式：

【化 1 1】



50

で表され、

式中、 R_4 が H であり；

R_5 が、前記アミノ酸の側鎖又は第 2 水素であり；

b 及び w がそれぞれ、独立して、0 ~ 7 の整数であり、 v が、0 ~ 5 の整数であり、ただし；

b 、 v 、及び w の和が、少なくとも 3 であり；

b 及び w の和が、0 ~ 7 であり；

z が、1 又は 2 であり；

X が、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 及び $-S(=O)_2-$ から選択され；

Z_1 及び Z_2 がそれぞれ、独立して、 $-O-$ 、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-C(=O)NR-$ 、 $-NRC(=O)O-$ 、 $-C(=O)S-$ 、 $-SC(=O)-$ 、 $-OC(=O)O-$ 、 $-NRC(=O)O-$ 、 $-OC(=O)NR-$ 、及び $-NRC(=O)NR-$ からなる群から選択され；

b 、 v 、 w 、及び z の各場合における R_{11} 、 R_{12} 、 R_x 、 R_y 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、及び R_{17} がそれぞれ、独立して、H 又は $C_1 \sim C_6$ 脂肪族であり；

R 、 R_{13} 及び R_{18} がそれぞれ、独立して、H 又は $C_1 \sim C_6$ 脂肪族であり；

R_{19} が、H、 $C_1 \sim C_6$ 脂肪族、アミノ保護基、 $L_3-C(=O)-$ 、又は A_2 であり；

L_1 及び L_2 がそれぞれ、独立して、 $C_5 \sim C_{21}$ 脂肪族又は $C_4 \sim C_{20}$ ヘテロ脂肪族であり；

L_3 が、 $C_1 \sim C_{21}$ 脂肪族又は $C_2 \sim C_{20}$ ヘテロ脂肪族であり；

A_2 が、アミノ酸又はペプチドであり；

ここで、 R 、 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、 R_{18} 、 R_{19} 、 R_x 、 R_y 、 L_1 、 L_2 、及び L_3 のいずれかに存在するいずれかの脂肪族又はヘテロ脂肪族が、任意に置換される）

の化合物；

又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグである、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

q が 1 である、請求項 4 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 6】

n が 10 ~ 14 である、請求項 4 又は 5 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 7】

n が 24 ~ 30 であり、好ましくは、 n が 27 である、請求項 4 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 8】

m が 1 ~ 3 であり、好ましくは m が 2 である、請求項 4 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 9】

v が 2 ~ 5 であり、好ましくは b が 0 であり、より好ましくは w が 1 ~ 7 の整数である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 10】

R_x 、 R_y 、 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、及び R_{17} が、H である、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 11】

10

20

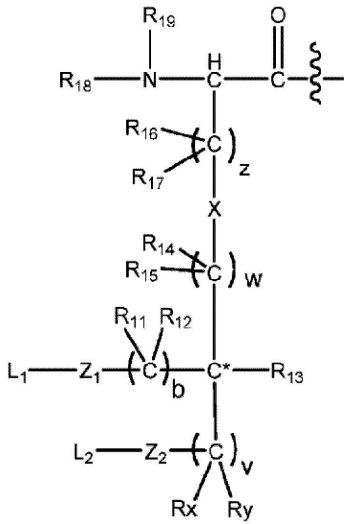
30

40

50

前記化合物が、* によって示されるキラル中心：

【化 1 2】

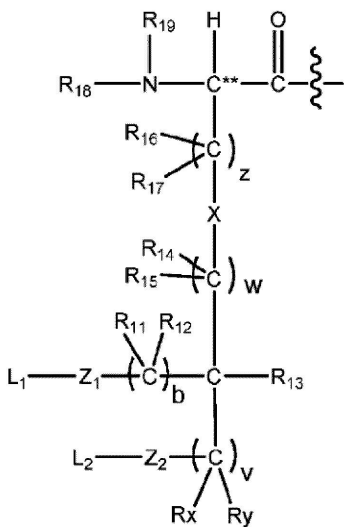


10

の周りの前記化合物の R 立体異性体である、及び / 又は

下式：

【化 1 3】



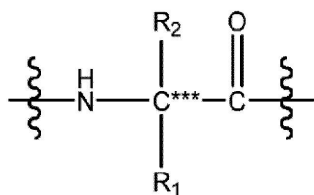
20

30

で** によって示されるキラル中心が、L 立体配置である、及び / 又は

下式：

【化 1 4】



40

で*** によって示されるキラル中心が、L 立体配置である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項 1 2】

以下の化合物 1 ~ 3 6

50

【化 1 5】

化合物構造	化合物名
	化合物1
	化合物2
	化合物3

10

20

30

40

50

	化合物4
	化合物5
	化合物6

10

20

30

40

50

$ \begin{array}{c} \text{H}_2\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{12}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2 \\ \qquad \qquad \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \text{CH}_2 \qquad \text{OH} \\ \\ \text{S} \\ \\ \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_{13}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH} \\ \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \\ \text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_{13}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} $	化合物7
$ \begin{array}{c} \text{H}_2\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{28}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2 \\ \qquad \qquad \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \text{CH}_2 \qquad \text{OH} \\ \\ \text{S} \\ \\ \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_{13}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH} \\ \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \\ \text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_{13}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} $	化合物8
$ \begin{array}{c} \text{H}_2\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{12}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2 \\ \qquad \qquad \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \text{CH}_2 \qquad \text{OH} \\ \\ \text{S} \\ \\ \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_{13}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH} \\ \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \\ \text{H}_3\text{C}(\text{CH}_2)_{13}-\text{N}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} $	化合物9

10

20

30

40

50

$ \begin{array}{c} \text{H}_2\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{28}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2 \\ \qquad \qquad \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \qquad \\ \text{S} \qquad \qquad \text{OH} \\ \\ \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}-(\text{CH}_2)_{13}-\text{N}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH} \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}-(\text{CH}_2)_{13}-\text{N}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} $	化合物10
$ \begin{array}{c} \text{H}_3\text{C}-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{12}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2 \\ \qquad \qquad \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \qquad \\ \text{S} \qquad \qquad \text{OH} \\ \\ \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}-(\text{CH}_2)_{14}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH} \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}-(\text{CH}_2)_{14}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} $	化合物11
$ \begin{array}{c} \text{H}_3\text{C}-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{C}(\text{H})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_{28}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{N}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2 \\ \qquad \qquad \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \qquad \\ \text{S} \qquad \qquad \text{OH} \\ \\ \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}-(\text{CH}_2)_{14}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH} \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \qquad \qquad \text{CH}_2 \\ \\ \text{H}_3\text{C}-(\text{CH}_2)_{14}-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{O} \end{array} $	化合物12

10

20

30

40

50

	化合物16
	化合物17
	化合物18

10

20

30

40

50

	化合物19
	化合物20
	化合物21

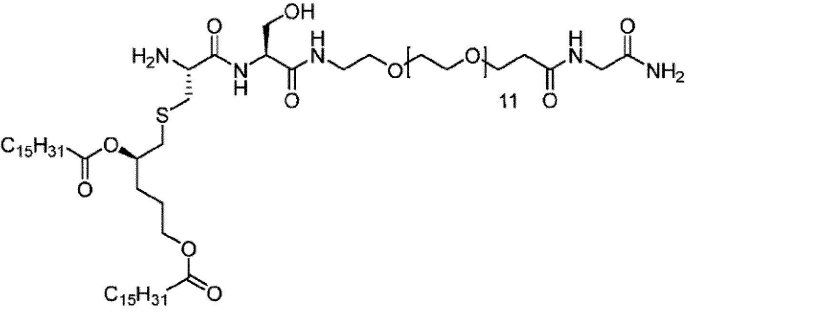
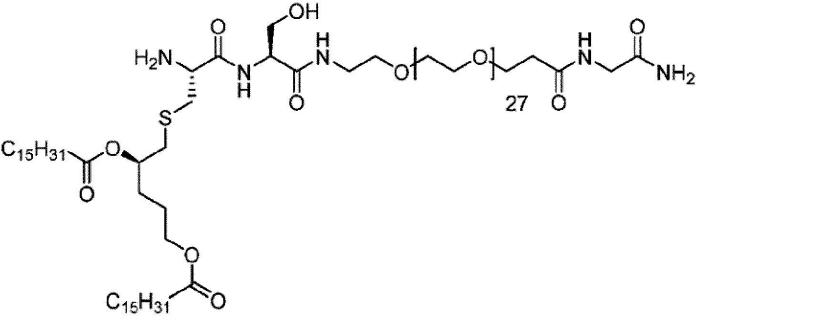
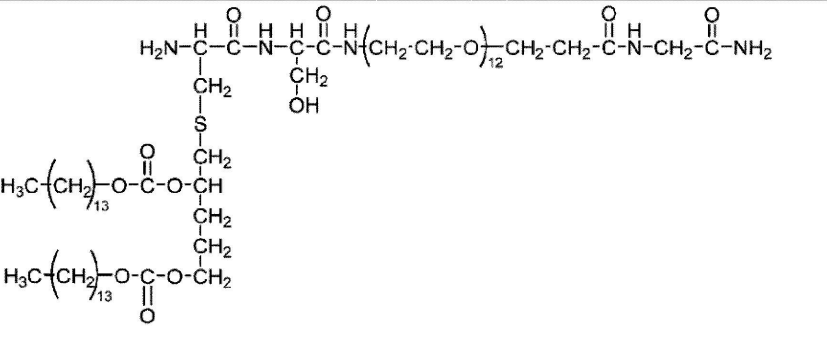
10

20

30

40

50

	化合物25
	化合物26
	化合物27

10

20

30

40

50

<p>Chemical structure of Compound 28: A poly(ethylene glycol) chain with terminal amide groups, a hydroxyl group, and two long-chain fatty acid ester groups (C₁₃).</p>	化合物28
<p>Chemical structure of Compound 29: A poly(ethylene glycol) chain with terminal amide groups, a hydroxyl group, and two long-chain fatty acid ester groups (C₁₄H₂₉).</p>	化合物29
<p>Chemical structure of Compound 30: A poly(ethylene glycol) chain with terminal amide groups, a hydroxyl group, and two long-chain fatty acid ester groups (C₁₄H₂₉).</p>	化合物30

10

20

30

40

50

	化合物31
	化合物32
	化合物33

10

20

30

40

50

	化合物34
	化合物35
	化合物36

10

20

のいずれか1つから選択される、請求項1～1.1のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

30

【請求項1.3】

請求項1～1.2のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ、及び薬学的に許容される担体、希釈剤又は賦形剤を含む組成物。

【請求項1.4】

対象における自然免疫応答を高めるため、
対象における感染因子によって引き起こされる疾患を予防するため、
対象におけるウイルス若しくは細菌感染に関連する呼吸器疾患若しくは病態を治療及び/又は予防するため、
対象における呼吸器感染症を治療及び/又は予防するため、
対象における気道炎症を軽減するため、
対象における呼吸器ウイルス感染中に呼吸器疾患若しくは病態を制御するためであって、好ましくは前記感染がライノウイルス感染でない、呼吸器ウイルス感染中に呼吸器疾患若しくは病態を制御するため、

40

TLR2受容体に関連する疾患若しくは病態を治療及び/又は予防するため
 のうちの1以上のために使用される、請求項1～1.2のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグ。

【請求項1.5】

細胞内のTLR2活性に作動する方法であって、前記細胞を、請求項1～1.2のいずれ

50

か一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩、溶媒和物若しくはプロドラッグと接触させることを含む方法。

10

20

30

40

50