

【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28年4月28日(2016.4.28)

【公表番号】特表2015-511957(P2015-511957A)

【公表日】平成27年4月23日(2015.4.23)

【年通号数】公開・登録公報2015-027

【出願番号】特願2014-560367(P2014-560367)

【国際特許分類】

C 07 F	9/38	(2006.01)
A 61 K	31/675	(2006.01)
A 61 P	37/04	(2006.01)
A 61 K	39/39	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 K	39/00	(2006.01)
C 07 C	279/14	(2006.01)

【F I】

C 07 F	9/38	B
A 61 K	31/675	
A 61 P	37/04	
A 61 K	39/39	
A 61 K	45/00	
A 61 K	39/00	G
C 07 C	279/14	Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成28年3月4日(2016.3.4)

【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】

3-(5-アミノ-2-(2-メチル-4-(2-(2-(2-ホスホエトキシ)エトキシ)エトキシ)フェネチル)ベンゾ[*f*][1,7]ナフチリジン-8-イル)プロパン酸のアルギニン塩。

【請求項2】

化学量論が1:1のアルギニンと3-(5-アミノ-2-(2-メチル-4-(2-(2-ホスホエトキシ)エトキシ)エトキシ)フェネチル)ベンゾ[*f*][1,7]ナフチリジン-8-イル)プロパン酸を有する、請求項1に記載の塩。

【請求項3】

前記アルギニン塩がL-アルギニン塩である、請求項1から2のいずれか一項に記載の塩。

【請求項4】

水和されている、請求項1から3のいずれか一項に記載の塩。

【請求項5】

一水和物である、請求項1から4のいずれか一項に記載の塩。

【請求項6】

実質的に非晶質固体である、請求項1から5のいずれか一項に記載の塩。

【請求項 7】

治療に使用するための、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の塩を含む組成物。

【請求項 8】

治療に使用するための医薬品の製造における、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の塩の使用。

【請求項 9】

前記治療が、被験体において免疫応答を引き起こす方法である、請求項 7 記載の組成物または請求項 8 に記載の塩の使用。

【請求項 10】

被験体において免疫応答を引き起こすための組成物であって、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の塩を含む、組成物。

【請求項 11】

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - メチル - 4 - (2 - (2 - (2 - ホスホノエトキシ) エトキシ) エトキシ) フェネチル) ベンゾ [f] [1, 7] ナフチリジン - 8 - イル) プロパン酸を、溶媒中でアルギニンと接触させるステップを含む、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載のアルギニン塩を調製する方法。

【請求項 12】

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - メチル - 4 - (2 - (2 - (2 - ホスホノエトキシ) エトキシ) エトキシ) フェネチル) ベンゾ [f] [1, 7] ナフチリジン - 8 - イル) プロパン酸のアルギニン塩および不溶性金属塩を含む、組成物。

【請求項 13】

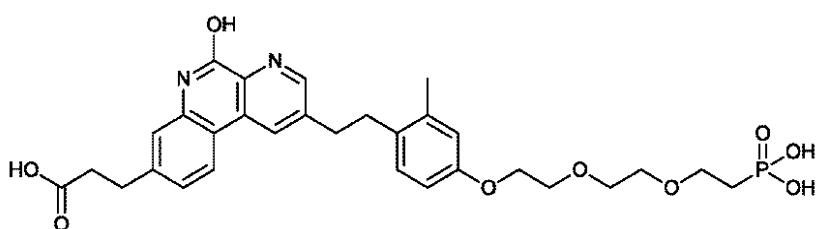
免疫原をさらに含む、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

アジュバント複合体を調製する方法であって、3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - メチル - 4 - (2 - (2 - ホスホノエトキシ) エトキシ) エトキシ) フェネチル) ベンゾ [f] [1, 7] ナフチリジン - 8 - イル) プロパン酸のアルギニン塩を、該酸が不溶性金属塩に吸着して該複合体を形成するように、該不溶性金属塩と混合するステップを含む、方法。

【請求項 15】

式 (Ia) の化合物

【化101】

またはその塩（例えば、L - アルギニン塩を含むアルギニン塩）もしくは溶媒和物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0148

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0148】

本発明に従って用いられる亜リン酸含有基は、周囲環境の pH、例えばそれらの基が溶解する溶媒の pH に応じて、いくつかのプロトン化および脱プロトン化形態で存在し得る。したがって、特定の形態が例示されているが、別段言及されない限り、これらの例示は

単に代表的なものであり、特定のプロトン化または脱プロトン化形態に限定することを意図するものではない。例えば、リン酸基の場合、リン酸基は - O P (O) (OH)₂ と例示されているが、その定義には、プロトン化形態である - [O P (O) (OH₂) (OH)]⁺ および - [O P (O) (OH₂)₂]²⁺、ならびに脱プロトン化形態である - [O P (O) (OH) (O)]⁻ および [O P (O) (O)₂]²⁻ が含まれ、これらは例えば異なる pH 値で存在し得る。

本発明は、例えば、以下の項目も提供する。

(項目 1)

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - メチル - 4 - (2 - (2 - (2 - ホスホノエトキシ) エトキシ) エトキシ) フェネチル) ベンゾ [f] [1, 7] ナフチリジン - 8 - イル) プロパン酸のアルギニン塩。

(項目 2)

化学量論が 1 : 1 のアルギニンと 3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - メチル - 4 - (2 - (2 - ホスホノエトキシ) エトキシ) エトキシ) フェネチル) ベンゾ [f] [1, 7] ナフチリジン - 8 - イル) プロパン酸を有する、項目 1 に記載の塩。

(項目 3)

前記アルギニン塩が L - アルギニン塩である、項目 1 から 2 のいずれか一項に記載の塩。

(項目 4)

水和されている、項目 1 から 3 のいずれか一項に記載の塩。

(項目 5)

一水和物である、項目 1 から 4 のいずれか一項に記載の塩。

(項目 6)

実質的に非晶質固体である、項目 1 から 5 のいずれか一項に記載の塩。

(項目 7)

治療に使用するための、項目 1 から 6 のいずれか一項に記載の塩。

(項目 8)

治療に使用するための医薬品の製造における、項目 1 から 6 のいずれか一項に記載の塩の使用。

(項目 9)

前記治療が、被験体において免疫応答を引き起こす方法である、項目 7 または 8 のいずれか一項に記載の、使用するための塩または塩の使用。

(項目 10)

被験体において免疫応答を引き起こす方法であって、前記被験体に、項目 1 から 6 のいずれか一項に記載の治療有効量の塩を投与するステップを含む、方法免疫応答を引き起こす。

(項目 11)

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - メチル - 4 - (2 - (2 - (2 - ホスホノエトキシ) エトキシ) エトキシ) フェネチル) ベンゾ [f] [1, 7] ナフチリジン - 8 - イル) プロパン酸を、溶媒中でアルギニンと接触させるステップを含む、項目 1 から 6 のいずれか一項に記載のアルギニン塩を調製する方法。

(項目 12)

3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - メチル - 4 - (2 - (2 - (2 - ホスホノエトキシ) エトキシ) エトキシ) フェネチル) ベンゾ [f] [1, 7] ナフチリジン - 8 - イル) プロパン酸のアルギニン塩および不溶性金属塩を含む、組成物。

(項目 13)

免疫原をさらに含む、項目 12 に記載の組成物。

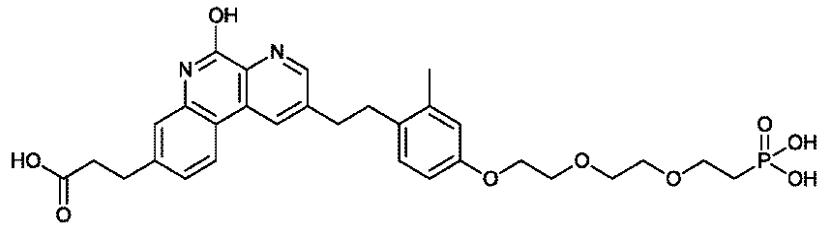
(項目 14)

アジュバント複合体を調製する方法であって、3 - (5 - アミノ - 2 - (2 - メチル - 4 - (2 - (2 - ホスホノエトキシ) エトキシ) エトキシ) フェネチル) ベンゾ [

f] [1 , 7] ナフチリジン - 8 - イル) プロパン酸のアルギニン塩を、該酸が不溶性金属塩に吸着して該複合体を形成するように、該不溶性金属塩と混合するステップを含む、方法。

(項目 15)

式 (Ia) の化合物
【化 101】



またはその塩（例えば、L-アルギニン塩を含むアルギニン塩）もしくは溶媒和物。