

(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 국제특허출원의 출원공개공보(A)

(51) Int. Cl.⁶
A61K 38/02

(11) 공개번호 특1995-0702839

(43) 공개일자 1995년08월23일

(21) 출원번호	특1995-0700754		
(22) 출원일자	1995년02월27일		
번역문제출일자	1995년02월27일		
(86) 국제출원번호	PCT/AU 93/000441	(87) 국제공개번호	WO 94/005311
(86) 국제출원출원일자	1993년08월27일	(87) 국제공개일자	1994년03월17일
(81) 지정국	EP 유럽특허 : 오스트리아 벨지움 스위스 리히텐슈타인 독일 덴마크 스페인 프랑스 그리스 영국 아일랜드 이태리 룩셈부르크 모나코 네델란드 포르투갈 스웨덴		
	OA OAPI특허 : 베냉 부르키나파소 카메룬 중앙아프리카 공화국 차드 콩고 가봉 말리 모리타니아 니제르 세네갈 토고 코트디부와르 기니아		
	국내특허 : 오스트리아 호주 바베이도스 불가리아 브라질 벨라루스 캐나다 스위스 리히텐슈타인 체코 독일 덴마크 스페인 핀란드 영국 헝가리 일본 북한 대한민국 카자흐스탄 스리랑카 룩셈부르크 마다가스카르 몽고 말라위 네델란드 노르웨이 뉴질랜드 폴란드 포르투갈 루마니아 러시아연방 수단 스웨덴 슬로바키아 우크라이나 미국 베트남 차이나 라트비아 우즈베키스탄 체코슬로바키아		
(30) 우선권 주장	PL4374 1992년08월27일 오스트레일리아(AU)		
(71) 출원인	데킨 리서치 리미티드(DEAKIN RESEARCH LIMITED) 스티븐 덕		
	오스트레일리아 뉴 사우스 웨일즈 2060 노오쓰 시드니 마운트 스트리트 80 레벨 1		
(72) 발명자	알피오 코미스		
	오스트레일리아 뉴 사우스 웨일즈 2176 보슬러 파크 프레리 베일 로드 3		
	피터 피셔		
	노르웨이 엔-0371 오슬로 가우스타달라인 21 니코메드 비오레그 에이에스내		
	마가렛 이사벨 타일러		
	오스트레일리아 뉴 사우스 웨일즈 2074 터라우라 트렌티노 로드 43 에이		
(74) 대리인	장용식, 정진상		

심사청구 : 없음

(54) 레트로-, 인버소-, 및 레트로- 인버소 합성 펩티드 유사체(RETRO-, INVERSO-, AND RETRO-INVERSO SYNTHETIC PEPTIDE ANALOGUES)

요약

부분적인 또는 완전한 레트로-, 인버소 또는 레트로-인버소 변형을 갖는 천연펩티드 항원의 합성펩티드 항원 유사체가 제공된다. 면역능력있는 숙주에 면역원으로서 투여했을때 합성펩티드 항원 유사체는 천연펩티드 항원을 인식하는 항체의 생성을 유도한다. 또한 이러한 유사체의 이용, 백신 및 이 항원 유사체를 함유하는 백신의 제조방법, 그리고 이 항원 유사체를 이용하여 생성된 항체가 제공된다.

대표도

도1

명세서

[발명의 명칭]

레트로-, 인버소-, 및 레트로- 인버소 합성 펩티드 유사체(RETRO-, INVERSO-, AND RETRO-INVERSO SYNTHETIC PEPTIDE ANALOGUES)

[도면의 간단한 설명]

제1도는 본발명에 따라서 아미노산 서열에 행해질 수 있는 변형을 예시한다. R¹, R², R³ 및 R⁴는 아미노산 측쇄를 나타내고, Xaa는 어떤 아미노산 잔기를 나타낸다.

제2도는 여러가지의 고정화된 펩티드-BSA에 대한 레트로-인버스 모델(mod) 펩티드-KLH 항혈청의 ELISA의 결과를 나타낸다-noMod(□), riMod(+), reMod(◇), inMod(△), 콘트롤1(X), 콘트롤2(▽),

제3도는 펩티드-BSA에 대한 말라리아(Ma l)-펩티드 항혈청(경구 면역화)의 ELISA의 결과를 나타낸다-혈청/고정화된 항원 : riMa l/riMa l(△), riMa l/moMa l(+), noMa l/noMa l(□), noMa l/riMa l(◇), 비-면역혈청/noMa l(X).

제4도는 고정화된 펩티드-BSA에 대한 디프테리아(DIP) 펩티드-KLH 항혈청의 ELISA의 결과를 나타낸다-혈청/고정화된 항원:riDip/riDiP(△), riDip/noDip(+), noDip/noDip(□), noDip/riDip(◇), 비-면역/noDip(X).

제5도는 고정화된 디프테리아 독소에 대한 디프테리아(Dip) 펩티드-KLH 항혈청의 ELISA의 결과를 나타낸다-항-riDip(+), 항-noDip(□), 비-면역혈청(◇).

제6도는 고정화된 디프테리아 독소에 대해 경구적으로 유도된 디프테리아(Dip) 펩티드 항혈청의 ELISA의 결과를 나타낸다-항-noDip, 2주일(□), 항-riDip, 2주일(+), 항-riDip, 8주일(◇).

본 내용은 요구공개 건이므로 전문 내용을 수록하지 않았음

(57) 청구의 범위

청구항 1

천연펩티드 항원의 합성펩티드 항원 유사체에서, 이 유사체는 천연항원에 대해서 부분적으로 또는 완전히 레트로 변형된 것을 특징으로 하는 합성펩티드 항원 유사체.

청구항 2

천연펩티드 항원의 합성펩티드 항원 유사체에서, 이 유사체는 천연항원에 대해서 부분적으로 또는 완전히 인버스 변형된 것을 특징으로 하는 합성펩티드 항원 유사체.

청구항 3

천연펩티드 항원의 합성펩티드 항원 유사체에서, 이 유사체는 천연항원에 대해서 부분적으로 또는 완전히 레트로-인버스 변형된 것을 특징으로 하는 합성펩티드 항원 유사체.

청구항 4

제3항에 있어서, 레트로-인버스 변형된 서열의 측면부의 아미노산 잔기가 측쇄-유사한 α -치환된 게니말-디아미노메탄 및 말로네이트에 의해 치환된 것을 특징으로 하는 항원 유사체.

청구항 5

제1항 내지 제4항중 어느 한항에 있어서, 면역능력있는 숙주를 면역화시키는데 사용되는 것을 특징으로 하는 합성 펩티드 항원 유사체.

청구항 6

제1항 내지 제5항중 어느 한항에 있어서, 천연항원은 천연적으로 존재하는 폴리펩티드 또는 그것의 항원성 단편인 것을 특징으로 하는 항원 유사체.

청구항 7

제1항 내지 제6항중 어느 한항에 있어서, 항원 유사체는 P.falciparum 스포로 조이트의 스포로조이트 주위 외피단백질의 면역우세 에피토프, 또는 디프테리아 독소항원, 또는 로부스톡신, 또는 간염 바이러스 항원, 또는 HIV항원의 유사체인 것을 특징으로 하는 항원 유사체.

청구항 8

제2항 또는 제3항에 있어서, 대응하는 천연항원으로 얻어지는 면역반응보다 더 오래 지속되는 면역반응을 일으킬 수 있는 것을 특징으로 하는 항원 유사체.

청구항 9

제약학적으로 허용가능한 담체, 희석제, 부형제 및/또는 보조제와 함께 제1항 내지 제8항중 어느 한 항에 따른 항원 유사체를 함유하는 백신.

청구항 10

숙주에 투여하는데 적당한 담체분자와 컨주게이션된 제1항 내지 제8항중 어느 한항에 따른 항원 유사체를 함유하는 백신.

청구항 11

제3항에 따른 항원 유사체를 함유하는 백신에서, 그 유사체 에피토프의 유사체이고, C 및 N 말단을 보호하도록 유사체가 변형된 것을 특징으로 하는 백신.

청구항 12

제1항 내지 제8항중 어느 한항에 따른 항원유사체 또는 제9항 내지 제11항중 어느 한항에 따른 백신에 대해서 만들어진 항체.

청구항 13

백신 접종치료가 필요한 숙주의 백신접종방법에서, 이 방법은 제1항 내지 제8항중 어느 한항에 따른 항원 유사체 또는 제9항 내지 제12항중 어느한 항에 따른 백신의 유효량을 숙주에 투여하는 것으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 14

포지티브 및 네가티브 콘트롤 표준물과 함께 제12항에 따른 항체 또는 제1항 내지 제8항중 어느 한 항에 따른 항원 유사체를 함유하는 진단 키트.

청구항 15

천연 펩티드 항원의 유사체를 제조하는 방법에서, 천연펩티드 항원의 부분적인 또는 완전한 레트로, 인버소 또는 레트로-인버소 유사체를 합성하는 것으로 이루어지는 방법.

청구항 16

천연 펩티드 항원에 대한 백신의 제조방법에서, 천연펩티드 항원의 레트로, 인버소 또는 레트로-인버소 유사체를 제공하고 제약학적으로 또는 수의학적으로 허용가능한 담체, 희석제, 부형제 및/또는 보조제와 함께 항원 유사체의 유효량을 혼합하는 것으로 이루어지는 것을 특징으로 하는 방법.

청구항 17

제15항에 있어서, 이 방법은 부가적으로 항원 유사체를 적당한 담체분자에 컨쥬게이션시키는 것을 포함하는 것을 특징으로 하는 방법.

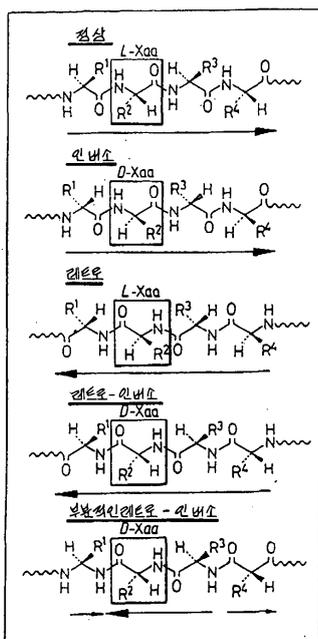
청구항 18

천연펩티드 항원에 대해 샘플을 분석하는 방법에서, 그 항원을 인식하는 제12항에 따른 항체의 사용을 포함하는 것을 특징으로 하는 방법.

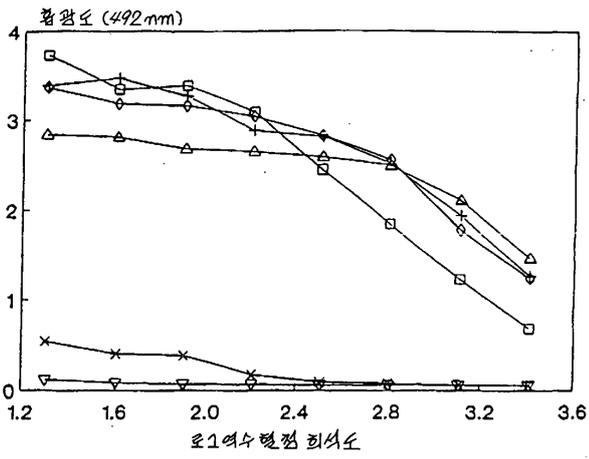
청구항 19

항체에 대해 샘플을 분석하는 방법에서, 그 항체에 결합할 수 있는 제1항 내지 제8항중 어느 한항에 따른 항원 유사체의 사용을 포함하는 것을 특징으로 하는 방법.

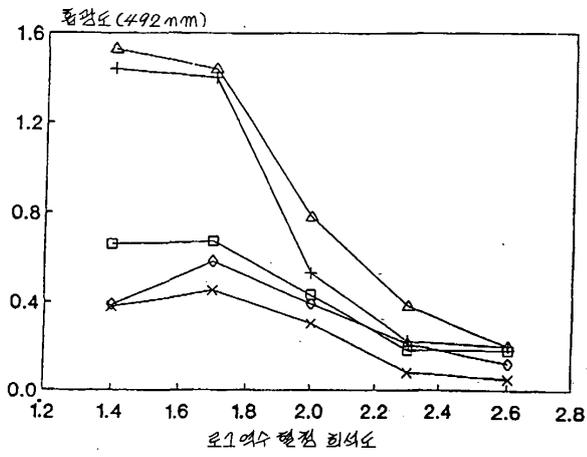
※ 참고사항 : 최초출원 내용에 의하여 공개하는 것임.

도면**도면1**

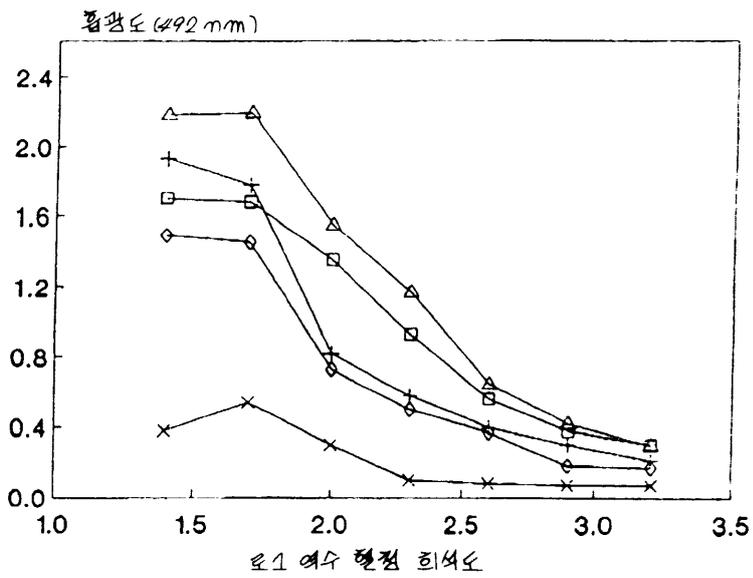
도면2



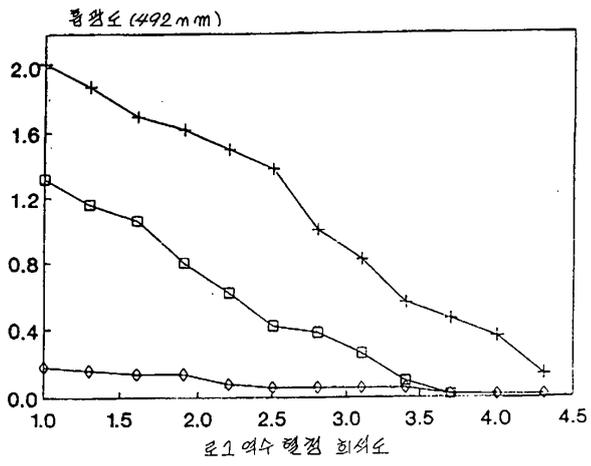
도면3



도면4



도면5



도면6

