

【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11月22日(2018.11.22)

【公表番号】特表2017-537062(P2017-537062A)

【公表日】平成29年12月14日(2017.12.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-048

【出願番号】特願2017-519672(P2017-519672)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|--------|-----------|
| A 6 1 K | 47/64 | (2017.01) |
| C 0 7 K | 2/00 | (2006.01) |
| C 0 7 K | 16/00 | (2006.01) |
| C 0 7 K | 14/705 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/60 | (2017.01) |
| A 6 1 K | 47/34 | (2017.01) |
| A 6 1 K | 47/42 | (2017.01) |
| A 6 1 K | 45/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |

【F I】

| | | |
|---------|--------|-------|
| A 6 1 K | 47/64 | |
| C 0 7 K | 2/00 | |
| C 0 7 K | 16/00 | |
| C 0 7 K | 14/705 | |
| A 6 1 K | 47/60 | |
| A 6 1 K | 47/34 | |
| A 6 1 K | 47/42 | |
| A 6 1 K | 45/00 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 0 5 |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 1 1 |

【手続補正書】

【提出日】平成30年10月9日(2018.10.9)

【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

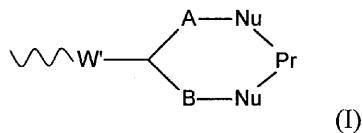
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

タンパク質又はペプチドと治療剤、診断剤、又は標識化剤とのコンジュゲートであって、前記コンジュゲートが、タンパク質又はペプチド結合部分を含有し、かつ前記治療剤、診断剤、又は標識化剤を前記タンパク質又はペプチド結合部分に接続するリンクーを有し、前記リンクーがポリエチレングリコール部分を含み、前記タンパク質又はペプチド結合部分が、一般式：

【化1】



(式中、Prは、前記タンパク質又はペプチドを表し、各Nuは、タンパク質又はペプチド中に存在するか又はそこに付加されている求核試薬を表し、A及びBの各々は、独立して、C₁~₄アルキレン又はアルケニレン鎖を表し、W'は、電子求引性基又は電子求引性基の還元によって得られる基を表す)

を有し、前記ポリエチレングリコール部分が、式-CH₂CH₂OR(式中、Rは、水素原子、アルキル基、又は場合により置換されているアリール基を表す)の末端基を有するペンダントポリエチレングリコール鎖であるか又はこれを含む、コンジュゲート。

【請求項1】

Rが水素原子又はC₁~₄アルキル基を表す、請求項1に記載のコンジュゲート。

【請求項2】

前記ペンダントポリエチレングリコール鎖が、最大75,000g/モルの数平均分子量を有する、請求項1又は2に記載のコンジュゲート。

【請求項3】

前記ペンダントポリエチレングリコール鎖が、2個~50個のポリエチレングリコール単位を含有する、請求項3に記載のコンジュゲート。

【請求項4】

各Nuが、タンパク質又はペプチドPrのシステイン残基に存在する硫黄原子を表す、請求項1~4のいずれか一項に記載のコンジュゲート。

【請求項5】

各Nuが、タンパク質又はペプチドPrに付加されているポリヒスチジンタグに存在するイミダゾール基を表す、請求項1~4のいずれか一項に記載のコンジュゲート。

【請求項6】

治療剤を含む、請求項1~6のいずれか一項に記載のコンジュゲート。

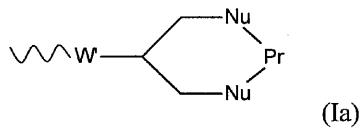
【請求項7】

タンパク質が、受容体若しくはリガンド結合性タンパク質又は抗体若しくは抗体断片である、請求項1~7のいずれか一項に記載のコンジュゲート。

【請求項8】

前記タンパク質又はペプチド結合部分が、式

【化2】



を有する、請求項1~8のいずれか一項に記載のコンジュゲート。

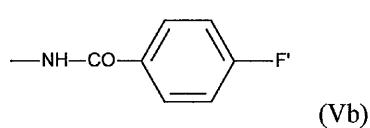
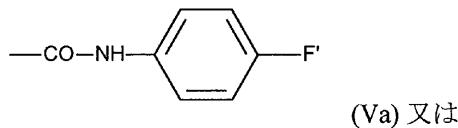
【請求項10】

W' がケト基又は CH_2OH 基を表す、請求項1~9のいずれか一項に記載のコンジュゲート。

【請求項11】

グルーピング：

【化3】



(式中、 F' は、式Iの前記タンパク質又はペプチド結合部分を表す)

を含む、請求項1~10のいずれか一項に記載のコンジュゲート。

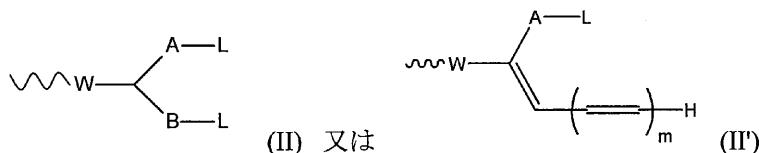
【請求項12】

前記ペンダントポリエチレングリコール鎖を2つ以上含む、請求項1~11のいずれか一項に記載のコンジュゲート。

【請求項13】

タンパク質又はペプチドと反応することができ、治療剤、診断剤、又は標識化剤を含む、コンジュゲート試薬であって、前記試薬が、前記治療剤、診断剤、又は標識化剤を官能グルーピングに接続するリンカーを有し、前記リンカーが、ポリエチレングリコール部分を含み、前記官能グルーピングが、式：

【化4】



(式中、 W は電子求引性基を表し、A及びBの各々は、独立して、 $C_1 \sim C_4$ アルキレン又はアルケニレン鎖を表し、各Lは、独立して、脱離基を表す)

を有し、前記ポリエチレングリコール部分が、式 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}$ (式中、Rは水素原子、アルキル基、又は場合により置換されているアリール基を表す)の末端基を有するペンダントポリエチレングリコール鎖であるか又はこれを含む、コンジュゲート試薬。

【請求項14】

Rが、水素原子又は $C_1 \sim C_4$ アルキル基を表す、請求項13に記載のコンジュゲート試薬。

【請求項15】

前記ペンダントポリエチレングリコール鎖が、最大75,000の分子量を有する、請求項13又は14に記載のコンジュゲート試薬。

【請求項16】

前記ペンダントポリエチレングリコール鎖が、2個~50個のポリエチレングリコール単位を含有する、請求項15に記載のコンジュゲート試薬。

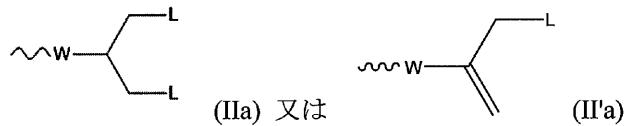
【請求項17】

治療剤を含む、請求項13~16のいずれか一項に記載のコンジュゲート試薬。

【請求項18】

前記官能グルーピングが、式

【化5】



を有する、請求項13～17のいずれか一項に記載のコンジュゲート試薬。

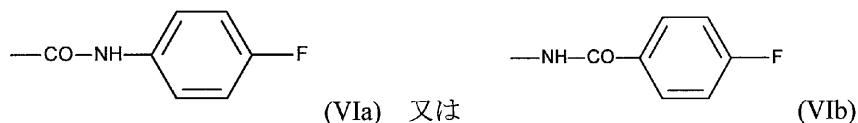
【請求項19】

Wがケト基を表す、請求項13～18のいずれか一項に記載のコンジュゲート試薬。

【請求項20】

グルーピング：

【化6】



(式中、Fは、式II又はII'の官能グルーピングを表す)

を含む、請求項13～19のいずれか一項に記載のコンジュゲート試薬。

【請求項21】

各Lが、-SP、-OP、-SO₂P、-OSO₂P、-N⁺PR²R³、ハロゲン、又は-O（式中、Pは、水素原子又はアルキル、アリール、若しくはアルキル-アリール基を表すか、或いは-(CH₂CH₂O)_n-（式中、nは、2以上の数である）部分を含む基であり、R²及びR³の各々は、独立して、水素原子、C₁～₄アルキル基、又はP基を表し、-は、少なくとも1個の電子吸引性置換基を含有する置換アリール基を表す）を表す、請求項13～20のいずれか一項に記載のコンジュゲート試薬。

【請求項22】

各Lが、式-SP又は-SO₂Pの基を表し、Pが、トシリル基又は-(CH₂CH₂O)_n-部分を含む基を表す、請求項21に記載のコンジュゲート試薬。

【請求項23】

2つ以上の前記ペンドントポリエチレングリコール鎖を含む、請求項13～22のいずれか一項に記載のコンジュゲート試薬。

【請求項24】

請求項13～23のいずれか一項に記載のコンジュゲート試薬を、タンパク質又はペプチドと反応させる工程を含む、請求項1～12のいずれか一項に記載のコンジュゲートの調製のための方法。