

【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8月25日(2016.8.25)

【公表番号】特表2015-524399(P2015-524399A)

【公表日】平成27年8月24日(2015.8.24)

【年通号数】公開・登録公報2015-053

【出願番号】特願2015-521961(P2015-521961)

【国際特許分類】

C 07 K	19/00	(2006.01)
A 61 K	39/395	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
C 12 N	15/115	(2010.01)
C 07 K	2/00	(2006.01)

【F I】

C 07 K	19/00	
A 61 K	39/395	Y
A 61 K	45/00	
A 61 P	35/00	
A 61 P	43/00	1 2 1
C 12 N	15/00	H
C 07 K	2/00	

【手続補正書】

【提出日】平成28年7月5日(2016.7.5)

【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)、TM-Ln-AM(I)の構造を有し、

式中、TMは、非腫瘍抗原と比較して、腫瘍抗原に特異的または優先的に結合することができる標的部分であり、

前記標的部分は、抗体またはその機能性フラグメントを含み、

AMは、ヒトTLR7およびTLR8に特異的に結合することができる活性化部分であり、Lnは、式、-Ta-Ww-Yyを有するリンカーであり、

式中、-T-は、ストレッチャー単位であり、aは、0または1であり、各-W-は、独立してアミノ酸単位であり、wは、独立して2~12の範囲の整数であり、-Y-は、スペーサー単位であり、yは、0、1、または2であり、

nは、0および1から選択される整数である、

ことを特徴とする化合物。

【請求項2】

前記標的部分は、非腫瘍細胞と比較して、腫瘍細胞に特異的または優先的に結合することができる、

ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記腫瘍細胞は、癌腫、肉腫、リンパ腫、骨髄腫、または中枢神経系癌のものである、ことを特徴とする請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

前記腫瘍抗原は、CD2、CD19、CD20、CD22、CD27、CD33、CD37、CD38、CD40、CD44、CD47、CD52、CD56、CD70、CD79、およびCD137からなる群から選択される、
ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

前記腫瘍抗原は、4-1BB、5T4、AGS-5、AGS-16、アンジオポエチン2、B7.1、B7.2、B7DC、B7H1、B7H2、B7H3、BT-062、BTLA、CAIX、癌胎児性抗原、CTLA4、クリプト(Cryptot)、ED-B、Erbb1、Erbb2、Erbb3、Erbb4、EGFL7、EpCAM、EphA2、EphA3、EphB2、FAP、フィブロネクチン、葉酸受容体、ガングリオシドGM3、GD2、グルココルチコイド誘発性腫瘍壞死因子受容体(GITR)、gp100、gpA33、GPNMB、ICOS、IGF1R、インテグリン、インテグリン、KIR、LAG-3、ルイスY、メソテリン、c-MET、MN炭酸脱水酵素IX、MUC1、MUC16、ネクチン-4、NKGD2、NOTCH、OX40、OX40L、PD-1、PDL1、PSCA、PSMA、RANKL、ROR1、ROR2、SLC44A4、シンデカン-1、TACI、TAG-72、テネイシン、TIM3、TRAILR1、TRAILR2、VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、およびこれらの変異体からなる群から選択される、

ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

前記抗体は、Rituxan(リツキシマブ)、Herceptin(トラスツズマブ)、Erbitux(セツキシマブ)、Vectibix(パニツムマブ)、Arzerra(オファツムマブ)、Benlysta(ベリムマブ)、Yervoy(イピリムマブ)、Perjeta(ペルツズマブ)、トレメリムマブ、ニボルマブ、ダセツズマブ、ウレルマブ(Urelumab)、MPDL3280A、ランブロリズマブ(Lambrolizumab)、およびブリナツモマブ(Blinatumomab)からなる群から選択される、

ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

前記標的部分は、Fab、Fab、F(ab)2、單一ドメイン抗体、TおよびAb二量体、Fv、scFv、dsFv、ds-scFv、Fd、線状抗体、ミニボディ、二特異性抗体(diabody)、二重特異的抗体フラグメント、バイボディ(bibody)、トリボディ(tribody)、sc-二特異性抗体、カッパ(ラムダ)体、BiTE、DVD-Ig、SIP、SMIP、DART、または1つ以上のCDRを含む抗体類縁体を含む、

ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

前記リンカーは、酵素切斷性である、

ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

前記リンカーは、酵素切斷性ではない、

ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

請求項1乃至9のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と、1つ以上の薬学的に許容される担体と、を含む、医薬組成物。

【請求項11】

第2の化学療法剤を更に含む、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記化学療法剤は、タモキシフェン、ラロキシフェン、アナストロゾール、エキセメスタン、レトロゾール、イマタニブ(imatinib)、パクリタキセル、シクロホスファミド、ロバスタチン、ミノシン(minosine)、ゲムシタビン、シタラビン、5-フルオロウラシル、メトレキセート、ドセタキセル、ゴセレリン、ピンクリスチン、ピンプラスチン、ノコダゾール、テニポシド、エトポシド、ゲムシタビン、エポチロン、ビノレルビン、カンプトテシン、ダウノルビシン、アクチノマイシンD、ミトキサントロン、アクリジン、ドキソルビシン、エピルビシン、またはイダルビシンからなる群から選択される。

ことを特徴とする請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

請求項1乃至9のいずれか1項に記載の化合物を含み、薬学的に許容される担体を更に含む、異常細胞増殖により特徴付けられる疾患状態の治療のための医薬組成物。

【請求項 1 4】

前記疾患状態は、腫瘍である、

ことを特徴とする請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

前記異常細胞増殖は、前癌性病変を含む、

ことを特徴とする請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記異常細胞増殖は、癌細胞のものである、

ことを特徴とする請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

前記癌は、乳癌、結腸直腸癌、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、子宮内膜癌、濾胞性リンパ腫、胃癌、神経膠芽腫、頭頸部癌、肝細胞癌、肺癌、黒色腫、多発性骨髄腫、卵巣癌、膀胱癌、前立腺癌、および腎細胞癌からなる群から選択される、

ことを特徴とする請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記活性化部分は、O R N 0 2、O R N 0 6、s s ポリ(U)、s s R N A 4 0、s s R N A 4 1、s s R N A - D R、ポリ(dT)、C L 0 7 5、C L 0 9 7、C L 2 6 4、C L 3 0 7、ガーディキモド、ロキソリビン、イミキモド、およびレスキモド(Resiquimod)からなる群から選択されるT L R 7 / 8のリガンドを含む、

ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。