

【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29年3月16日(2017.3.16)

【公表番号】特表2016-516079(P2016-516079A)

【公表日】平成28年6月2日(2016.6.2)

【年通号数】公開・登録公報2016-034

【出願番号】特願2016-503772(P2016-503772)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/737 (2006.01)

A 6 1 K 38/46 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 K 14/47 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/737

A 6 1 K 37/54

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 K 14/47 Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月7日(2017.2.7)

【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】

フコイダン部分の還元末端と1つ以上のアミノ基を含む化学基との間の共有結合によりアミノ化される、フコイダン部分からなるt-PA結合特性を有する媒介物。

【請求項2】

式(I)：

FUCO-C1-[NH]<sub>y</sub>-[L]<sub>z</sub>-[NH]<sub>x</sub>-R1 (I)

(式中、

- 「FUCO」が、フコイダン鎖に共有結合した1つ以上の1級アミン基を場合により含有する、フコイダン部分を意味し、

- x、y、及びzが、0又は1を意味する独立した整数であり、  
- C1が、フコイダン部分の還元末端に位置する糖単位の1位の炭素原子であり、  
- Lが、リンカーであり、  
- R1が、1つ以上のアミノ基を含むか、又は1つのアミノ基に存する化学基であり、

- L及びR1が、独立し、等しいか又は異なっていてもよい)

の化合物である、請求項1記載の媒介物。

【請求項3】

式(I) (式中、

- R1が、1級アミン末端の直鎖又は分岐炭化水素鎖を含むか、又はこれに存する化学基、アミノ酸、ポリアミノ酸、及び/又はリジン、ポリリジン、アルギニン、ポリアルギニン、オルニチン、ポリオルニチン、-アミノ酪酸、ポリアミン、ポリエーテルアミ

ン、又はグアニジン基若しくは1級アミンを含む任意の他の化学基を含むか、又はこれに存するリストにおいて選択される化学基であり、

ここで、

- 当該化学基が、5つ又は6つの炭素原子を有する1つ以上の非芳香族炭化水素環により場合により中断され、

- 当該化学基が、1つ以上のヘテロ原子により場合により中断され、

- 当該化学基が、1つ以上のアミド基及び/又は1つ以上のエステル基を場合により含有し、

- 当該化学基が、1つ以上のアミン基により場合により置換されており、

- 当該化学基が、(a)直鎖又は分岐炭化水素鎖、(b)アミノ酸又はポリアミノ酸、(c)ポリアミン又はポリエーテルアミン、(d)-アミノ酪酸、(e)グアニジン基、及び(f)1級アミンから選択される同一又は異なる1つ以上の基により場合により中断されるか、及び/又は置換される

の化合物である、請求項1又は2記載の媒介物。

【請求項4】

フコイダンが、フコイダン鎖に共有結合した基を含有する1級アミンを更に含む、請求項1~3のいずれか一項記載の媒介物。

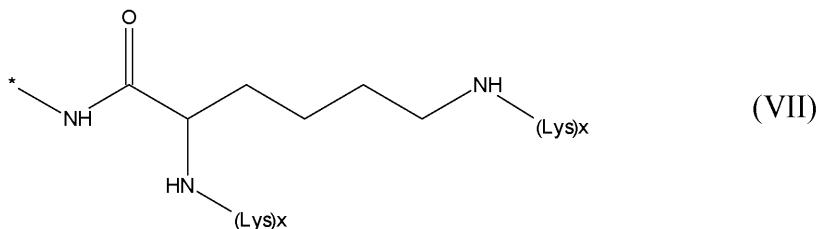
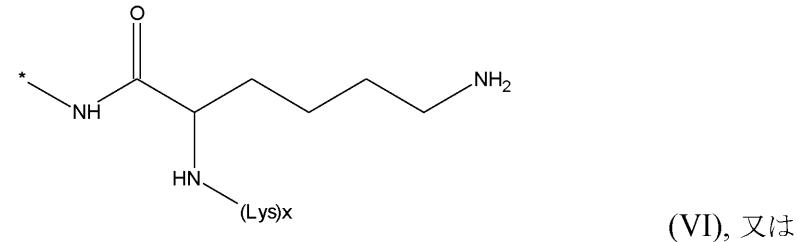
【請求項5】

R1又はLが1~4個のアミン基により置換されている、請求項1~4のいずれか一項記載の媒介物。

【請求項6】

[NH]<sub>x</sub>-R1が、式(VI)又は(VII)：

【化15】



(式中、

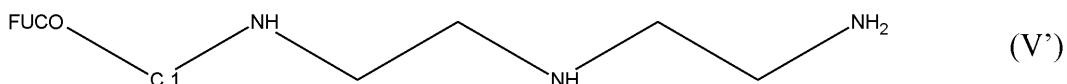
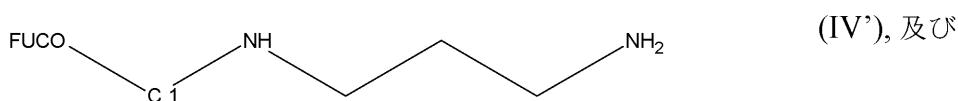
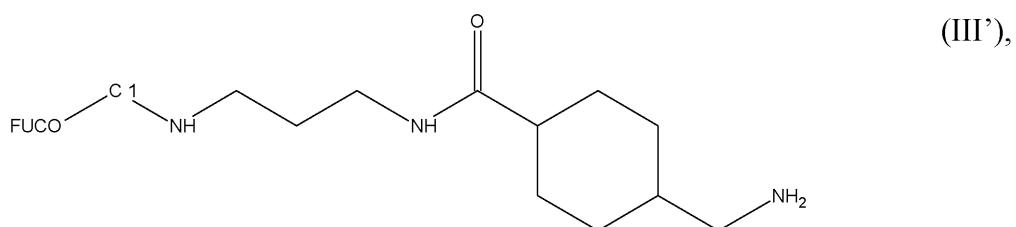
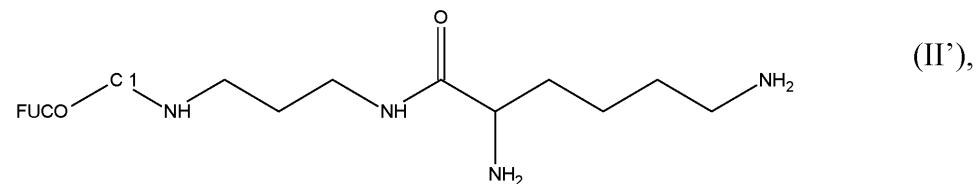
- <<Lys>>が、リジン又はリジン誘導体であり、

- xが、少なくとも1に等しいか又はそれより大きい)

のものである、請求項1~5のいずれか一項記載の媒介物。

【請求項7】

【化16】



からなる群より選択される、請求項1～6のいずれか一項記載の媒介物。

## 【請求項8】

フコイダン部分が、100000Da未満である平均分子量を有する、請求項1～7のいずれか一項記載の媒介物。

## 【請求項9】

フコイダン部分が、2000Da～15000Daの範囲にある平均分子量を有する、請求項1～8のいずれか一項記載の媒介物。

## 【請求項10】

フコイダン部分がポリ硫酸化される、請求項1～9のいずれか一項記載の媒介物。

## 【請求項11】

請求項1～10のいずれか一項記載の媒介物のt-PAとの複合体を含む、媒介物化されたt-PA。

## 【請求項12】

40:1～1:1の範囲にある媒介物のt-PAに対するモル比を有する、請求項11記載の媒介物化されたt-PA。

## 【請求項13】

医薬として使用するための、請求項11及び12のいずれか一項記載の媒介物化されたt-PA。

## 【請求項14】

対象における血栓を予防又は治療するための有効成分として使用するための、請求項11及び12のいずれか一項記載の媒介物化されたt-PA。

## 【請求項15】

- a) 請求項1～10のいずれか一項記載の媒介物を用意すること、
- b) t-PAを用意すること、及び

c ) ステップ a ) で用意された媒介物をステップ b ) で用意された t - P A と接触させて、当該媒介物と t - P A の間の複合体を得ることのステップを含む、媒介物化された t - P A を製造する方法。

【請求項 1 6】

- 請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項記載の媒介物を含む第 1 の容器、及び
- t - P A を含む第 2 の容器

を含む、キット。

【請求項 1 7】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項記載の媒介物及び t - P A を含み、当該媒介物及び当該 t - P A が無水形態である、容器。

【請求項 1 8】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項記載の媒介物の t - P A との複合体を含む、医薬組成物。