

【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 1 部門第 1 区分

【発行日】平成24年1月19日 (2012.1.19)

【公表番号】特表2011-507497(P2011-507497A)

【公表日】平成23年3月10日 (2011.3.10)

【年通号数】公開・登録公報2011-010

【出願番号】特願2010-538788(P2010-538788)

【国際特許分類】

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

C 1 2 N 1/15 (2006.01)

C 1 2 N 1/19 (2006.01)

C 1 2 N 1/21 (2006.01)

C 1 2 N 5/10 (2006.01)

C 0 7 K 14/00 (2006.01)

A 6 1 K 51/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

G 0 1 N 33/534 (2006.01)

【 F I 】

C 1 2 N 15/00 Z N A A

C 1 2 N 1/15

C 1 2 N 1/19

C 1 2 N 1/21

C 1 2 N 5/00 1 0 1

C 0 7 K 14/00

A 6 1 K 43/00

A 6 1 K 49/02 B

A 6 1 K 49/02 C

A 6 1 P 35/00

G 0 1 N 33/534

【手続補正書】

【提出日】平成23年11月25日 (2011.11.25)

【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】

位置 2 における X_1 が M、I 又は L であり、位置 39 における X_2 が S 又は C である、アミノ酸配列 $E X_1 R N A Y W E I A L L P N L T N Q Q K R A F I R K L Y D D P S Q S S E L L X_2 E A K K L N D S Q$ (配列番号 1) を含む HER2 結合ポリペプチド。

【請求項 2】

位置 5 における X_1 が M、I 又は L であり、位置 42 における X_2 が S 又は C である、アミノ酸配列 $Y A K E X_1 R N A Y W E I A L L P N L T N Q Q K R A F I R K L Y D D P S Q S S E L L X_2 E A K K L N D S Q$ (配列番号 2) を含む、請求項 1 に記載の HER2 結合ポリペプチド。

【請求項 3】

$A E A K Y A K E X_1 R N A Y W E I A L L P N L T N Q Q K R A F I R K L Y D D$

P S Q S S E L L X₂ E A K K L N D S Q (配列番号3)、及び

E S E K Y A K E X₁ R N A Y W E I A L L P N L T N Q Q K R A F I R K L Y D D

P S Q S S E L L X₂ E A K K L N D S Q (配列番号4)、

から選択され、ここでいずれも位置9におけるX₁がM、I又はLであり、位置46におけるX₂がS又はCである、アミノ酸配列を含む、請求項1又は2に記載のHER2結合ポリペプチド。

【請求項4】

A E A K Y A K E M R N A Y W E I A L L P N L T N Q Q K R A F I R K L Y D D
P S Q S S E L L S E A K K L N D S Q A P K V D C (配列番号5)、及び

E S E K Y A K E M R N A Y W E I A L L P N L T N Q Q K R A F I R K L Y D D
P S Q S S E L L S E A K K L N D S Q A P K (配列番号6)、

から選択されるアミノ酸配列を含む、請求項3に記載のHER2結合ポリペプチド。

【請求項5】

そのN末端にカップリングしたメルカプトアセチルを更に含む、請求項1～4のいずれか1項に記載のHER2結合ポリペプチドであって、N₃Sキレート剤モチーフによって構成されるキレート環境が、メルカプトアセチルのSH基と一緒にあってN末端からの最初の3つの連続したペプチド結合の窒素原子によって与えられるHER2結合ポリペプチド。

【請求項6】

配列中に既に存在するか、又は更なるアミノ酸残基として存在するか、又はHER2結合に関与しない表面に露出したアミノ酸残基を置換することによって存在するいずれかのシステイン残基を含む、請求項1～4のいずれか1項に記載のHER2結合ポリペプチド。

【請求項7】

請求項6に記載のHER2結合ポリペプチドであって、システイン残基が配列番号5のC末端に位置するものか又は更なるシステインが配列番号1～4若しくは6～7のいずれか1つのC末端に位置しており、ここでシステイン残基には、場合により1つ又はそれ以上の他のアミノ酸残基が続き、そしてここでN₃Sキレート剤モチーフによって構成されるキレート環境が、システイン残基のSH基と一緒にあって、システインによって構成されるアミノ酸残基及び2つの先行するアミノ酸残基の広がりの中の3つの連続したペプチド結合の窒素原子によって与えられる、HER2結合ポリペプチド。

【請求項8】

チオール基を介して、ポリペプチドにカップリングしたポリアミノポリカルボキシラートのキレート剤によって与えられるキレート環境を含む、請求項6に記載のHER2結合ポリペプチド。

【請求項9】

ポリアミノポリカルボキシラートのキレート剤が、1, 4, 7, 10-テトラアザシクロドデカン-1, 4, 7, 10-四酢酸又はその誘導体、及び、ジエチレントリアミンペンタ酢酸又はその誘導体、から選択される、請求項8に記載のHER2結合ポリペプチド。

【請求項10】

アミノ酸配列が配列番号5で表される、請求項9に記載のHER2結合ポリペプチド。

【請求項11】

HER2結合ポリペプチドと放射性核種との放射性キレートから成る放射性標識化ポリペプチドであって、該放射性キレートが、

- ・請求項5または7に記載のHER2結合ポリペプチドと、^{99m}Tcである医用画像に適した放射性核種とのものか、又は、⁸⁶Re及び¹⁸⁸Reから成るグループから選択される治療に適した放射性核種とのもの；
- ・請求項8～10のいずれか1項に記載のHER2結合ポリペプチドと、⁶¹Cu、⁶⁴Cu、⁶⁶Ga、⁶⁷Ga、⁶⁸Ga、^{110m}In、¹¹¹In、⁴⁴Sc及び⁸⁶Yから成るグループから

選択される医用画像に適した放射性核種とのものか、又は ^{225}Ac 、 ^{212}Bi 、 ^{213}Bi 、 ^6Cu 、 ^{166}Ho 、 ^{177}Lu 、 ^{212}Pb 、 ^{149}Pm 、 ^{153}Sm 、 ^{227}Th 及び ^{90}Y から成るグループから選択される治療に適した放射性核種とのもの、ここで、放射性核種は、キレート環境を介してHER2結合ポリペプチドと錯体を形成する；及び

・請求項6に記載のHER2結合ポリペプチドと、 ^{211}At 、 ^{76}Br 、 ^{18}F 及びヨウ素同位体から成るグループから選択される医用画像及び／又は治療に適した放射性核種が、リンカー分子を介して結合しているもの；

から選択される、上記放射性標識化ポリペプチド。

【請求項12】

^{18}F とリンカー分子を介して結合している配列番号5で表されるアミノ酸配列を含む、請求項11に記載の放射性標識化ポリペプチド。

【請求項13】

放射性核種が診断に用いるための画像化に適する、請求項11又は12に記載の放射性標識化ポリペプチド。

【請求項14】

請求項13に記載の診断に用いるための放射性標識化ポリペプチドであって、診断が以下の工程：

・放射性核種が画像化に適する請求項11又は12に記載の放射性標識ポリペプチドを、哺乳類対象の体内に投与すること；及び

・放射性標識ポリペプチドの投与の1～72時間以内に、医用画像機器を使用して、対象の体の少なくとも1部分の1つ又はそれ以上の画像、ここで、該画像は体の内部の放射性核種の存在を指示する、を取得すること；

を含む、上記放射性標識化ポリペプチド。

【請求項15】

治療に使用するための、放射性核種が治療に適する請求項11に記載の放射性標識化ポリペプチド。

【請求項16】

請求項1～4のいずれか1項に記載のHER2結合ポリペプチドから成る少なくとも1つの第一の部分、及び、連鎖球菌のタンパク質Gのアルブミン結合ドメインから成る少なくとも1つのさらなる部分、を含む、融合ポリペプチド。

【請求項17】

請求項1～4のいずれか1項に記載のHER2結合ポリペプチドから成る少なくとも1つの第一の部分、及び、治療への適用のための少なくとも1つの部分、を含む、融合ポリペプチド。

【請求項18】

請求項1～4及び6のいずれか1項に記載のポリペプチドをコードする核酸。