

【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 6 部門第 1 区分

【発行日】平成30年11月22日(2018.11.22)

【公表番号】特表2018-524577(P2018-524577A)

【公表日】平成30年8月30日(2018.8.30)

【年通号数】公開・登録公報2018-033

【出願番号】特願2017-565173(P2017-565173)

【国際特許分類】

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

G 0 1 N 33/53 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/16 (2006.01)

C 0 7 K 14/705 (2006.01)

C 0 7 K 14/525 (2006.01)

【 F I 】

G 0 1 N 33/15 Z N A Z

G 0 1 N 33/53 D

C 0 7 D 471/04 1 0 8 Q

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/08

A 6 1 K 31/496  
A 6 1 K 31/4439  
A 6 1 P 43/00 1 2 1  
A 6 1 K 38/16  
C 0 7 K 14/705  
C 0 7 K 14/525

【手続補正書】

【提出日】平成30年10月10日(2018.10.10)

【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】

腫瘍壊死因子 (TNF) スーパーファミリーメンバーであるトリマータンパク質に結合し、必要なTNFスーパーファミリー受容体を介するトリマータンパク質のシグナル伝達を調節することができる化合物を同定する方法であって、トリマー - 化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数を決定するステップ、それによって、化合物が受容体を介するシグナル伝達を調節することができるかどうかを同定するステップを含む、上記方法。

【請求項 2】

対照と比較して、トリマー - 化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数を決定するステップを含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

対照が、化合物の非存在下でTNFスーパーファミリーメンバーのトリマー及び必要な受容体を含み、任意に、対照と比較したトリマー - 化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数の減少が、化合物が受容体を介するシグナル伝達を調節することができることを同定する、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

対照が、TNFスーパーファミリーメンバーのトリマー、必要な受容体、及び受容体を介するトリマーのシグナル伝達を調節することが公知の化合物を含み、任意に対照と比較したトリマー - 化合物複合体あたりに結合した受容体の同等の平均数、又は対照と比較したトリマー - 化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数の減少が、化合物が受容体を介するシグナル伝達を調節することができることを同定する、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 5】

トリマー - 化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数が、3 : 1 ~ 10 : 1 (受容体 : トリマー) のモル比で決定される、請求項 1 から 4 のいずれか に記載の方法。

【請求項 6】

化合物が、トリマー - 化合物複合体あたりに平均 3 個未満の受容体が結合すると決定される場合、受容体を介するトリマータンパク質のシグナル伝達を調節できると同定される、請求項 1 から 5 のいずれか に記載の方法。

【請求項 7】

化合物が、トリマー - 化合物複合体あたりに平均 2 個の受容体が結合すると決定される場合、受容体を介するトリマータンパク質のシグナル伝達を調節できると同定される、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

化合物が、トリマー - 化合物複合体あたりに平均 1 個の受容体が結合すると決定される場合、受容体を介するトリマータンパク質のシグナル伝達を調節できると同定される、請求項 6 に記載の方法。

## 【請求項 9】

トリマー - 化合物複合体あたりに結合した受容体の数が、

- (a) イオン移動度質量分析；及び／又は
- (b) サイズ排除クロマトグラフィー；及び／又は
- (c) 凝集アッセイ；及び／又は
- (d) F o r s t e r 共鳴エネルギー移動；及び／又は
- (e) 結晶解析

によって決定される、請求項 1 から 8 のいずれか に記載の方法。

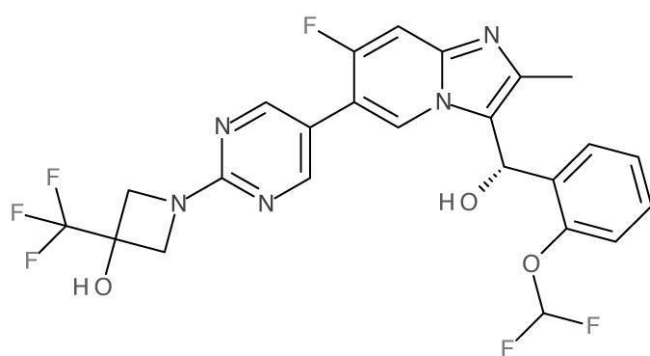
## 【請求項 10】

T N F スーパーファミリーメンバーが T N F であり、受容体が T N F - R である、請求項 1 から 9 のいずれか に記載の方法。

## 【請求項 11】

式 (5) の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

## 【化 1】



(5)

## 【請求項 12】

T N F スーパーファミリーメンバーであるトリマータンパク質と、請求項 11 に記載の化合物とを含む複合体。

## 【請求項 13】

ヒト又は動物の身体の治療のための、請求項 11 に記載の化合物又は請求項 12 に記載の複合体を含む剤。

## 【請求項 14】

化合物が受容体を介してトリマーによって誘導されるシグナル伝達に拮抗する、自己免疫障害及び炎症障害；神経障害及び神経変性障害；疼痛障害及び侵害障害；並びに心血管障害の処置及び／又は防止における使用のための、任意に関節リウマチ、クローン病、乾癬、全身性エリテマトーデス、アルツハイマー病、パーキンソン病及びてんかんの処置及び／又は防止における使用のための、請求項 13 に記載の剤。

## 【請求項 15】

請求項 11 に記載の化合物、又は請求項 12 に記載の複合体と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。