

【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23年11月10日(2011.11.10)

【公表番号】特表2010-540488(P2010-540488A)

【公表日】平成22年12月24日(2010.12.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-051

【出願番号】特願2010-526274(P2010-526274)

【国際特許分類】

C 07 K	14/705	(2006.01)
C 07 K	1/02	(2006.01)
C 07 K	14/00	(2006.01)
C 07 K	14/62	(2006.01)
C 07 K	14/765	(2006.01)
A 61 K	38/00	(2006.01)
A 61 K	38/28	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
G 01 N	33/48	(2006.01)
G 01 N	33/50	(2006.01)

【F I】

C 07 K	14/705	
C 07 K	1/02	
C 07 K	14/00	
C 07 K	14/62	
C 07 K	14/765	
A 61 K	37/02	
A 61 K	37/26	
A 61 P	43/00	1 0 5
G 01 N	33/48	A
G 01 N	33/50	T

【手続補正書】

【提出日】平成23年9月22日(2011.9.22)

【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

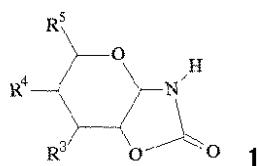
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

糖質-ペプチド複合体の調製方法であつて、該方法が、環状カルバメート(1)

【化1】



(ここで、R³及びR⁴が、独立して、ヒドロキシル、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択され；及び、R⁵が、水素、メチル、ヒドロキシメチル、アセトアミドメチル、カルボキシル、及びX-(CH₂)_r-からなる群から選択され、ここで、Xは糖

質部分であり、 r は 0、1、2 及び 3 から選択される整数である；) を、少なくとも 1 つの 1 級アミノ基を含むペプチドと、反応させるステップを含む方法。

【請求項 2】

反応が、例えば水のような極性溶媒中において行われる請求項 1 記載の方法。

【請求項 3】

反応が、pH 6.5 - 10.5 の範囲において行われる、請求項 1 又は 2 の記載の方法。

【請求項 4】

ペプチドが、少なくとも 30 のアミノ酸ユニットを含む、請求項 1 ないし 3 のいずれかに記載の方法。

【請求項 5】

ペプチドが、細胞表面又は細胞膜結合タンパク質である、請求項 1 ないし 4 のいずれかに記載の方法。

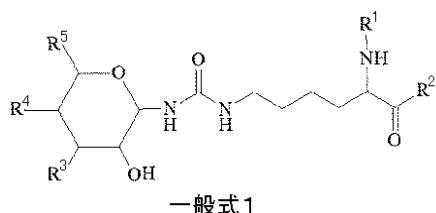
【請求項 6】

請求項 1 ないし 5 のいずれか記載の方法により得られる糖質 - ペプチド複合体。

【請求項 7】

一般式 1 :

【化 2】



(ここで、

R^1 及び R^2 は、間に存在するリジン部分と一緒にになって、ペプチド部分を表し；
 R^3 及び R^4 は、独立して、ヒドロキシル、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択され；

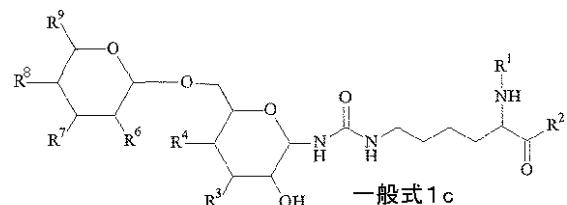
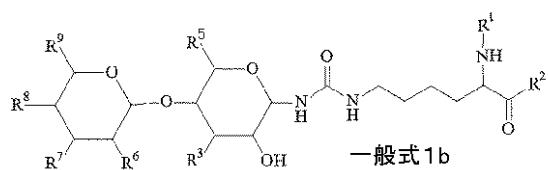
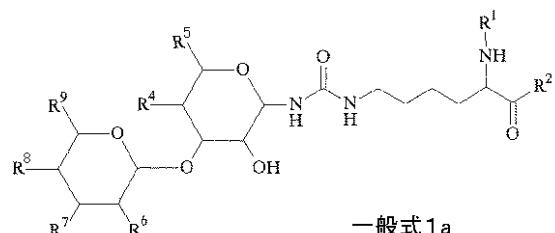
R^5 は、水素、メチル、ヒドロキシメチル、アセトアミドメチル、カルボキシル、及び $X - (CH_2)_r -$ からなる群から選択され、ここで、 X は糖質部分であり、 r は 0 及び 1 から選択される整数である；)

の 1 つ以上の部分を含む糖質 - ペプチド複合体、及びそれらの薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

一般式 1 a、1 b、及び 1 c

【化3】

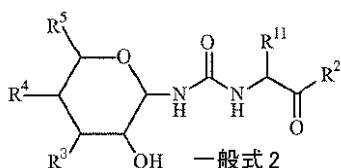


(ここで、R⁶及びR⁷は請求項1に記載のR³及びR⁴の定義と同一であり、R⁹は請求項1に記載のR⁵の定義と同一であり、R⁸はヒドロキシル、C₁₋₆-アルコキシ、C₂₋₂₀-アシリルオキシ、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択される。)のいずれか1つ以上の部分を含む、請求項7記載の糖質-ペプチド複合体。

【請求項9】

一般式2：

【化4】

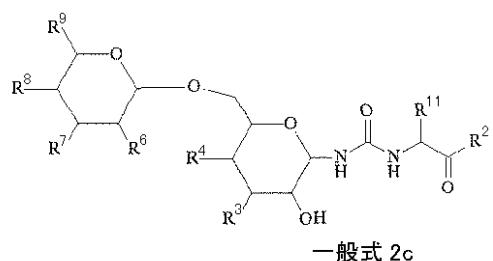
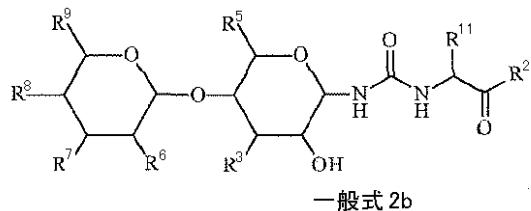
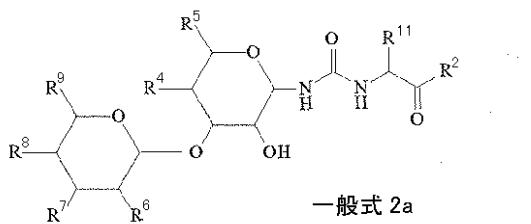


(ここで、R¹⁻¹はアミノ酸側鎖；
R²は-NH-CHR¹⁻¹-C(=O)-と一緒にになって、合計のアミノ酸が少なくとも30のペプチド部分を表し；
R³及びR⁴は、独立して、ヒドロキシル、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択され；
R⁵は、水素、メチル、ヒドロキシメチル、アセトアミドメチル、カルボキシル、及びX-(CH₂)_r-からなる群から選択され、ここでXは糖質部分であり、rは0、1、2及び3から選択される整数である；)
の1つ以上の部分を含む糖質-ペプチド複合体、及びそれらの薬学的に許容される塩。

【請求項10】

一般式2a、2b、及び2c

【化5】



(ここで、R⁶及びR⁷は、請求項1に記載のR³及びR⁴の定義と同一であり、R⁹は請求項1に記載のR⁵の定義と同一であり、及びR⁸は、ヒドロキシル、C₁-₆-アルコキシ、C₂-₂₀-アシリルオキシ、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択される。)

の1つ以上の部分を含む請求項9記載の糖質-ペプチド複合体。

【請求項11】

グリコシル部分(糖質部分)が、非免疫原性糖質を表す請求項6ないし10のいずれか記載の糖質-ペプチド複合体。

【請求項12】

グリコシル部分(糖質部分)が、免疫原性糖質を表す請求項6ないし10のいずれか記載の糖質-ペプチド複合体。

【請求項13】

糖質-ペプチド複合体が、細胞表面又は細胞膜結合タンパク質である請求項6ないし12のいずれか記載の糖質-ペプチド複合体。

【請求項14】

ペプチド部分のアミノ酸ユニットの合計数が少なくとも30、特に少なくとも100である請求項6ないし13のいずれかにおいて定義される糖質-ペプチド複合体。

【請求項15】

糖質-ペプチド複合体が、請求項6ないし14のいずれかにおいて定義される化合物である、請求項1ないし5のいずれか記載の方法。

【請求項16】

医薬品を製造するための、請求項6ないし14のいずれかにおいて定義される糖質-ペプチド複合体の使用。

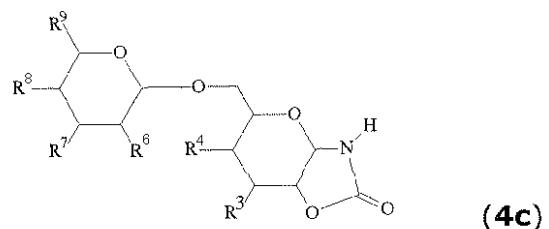
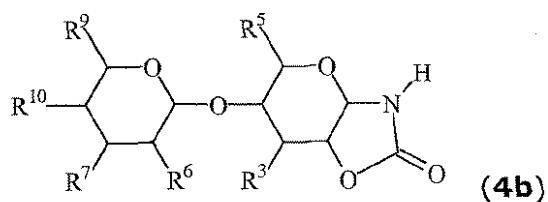
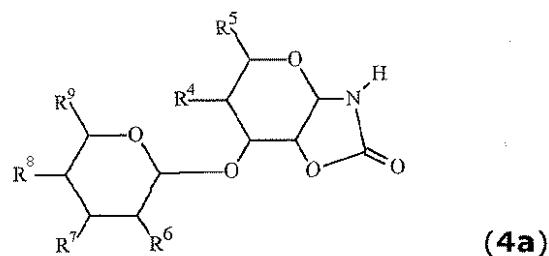
【請求項17】

薬剤、診断用剤、又は診断用キットを製造するための、請求項6ないし14のいずれか記載の糖質-ペプチド複合体の使用。

【請求項18】

(4a)、(4b)及び(4c)

【化6】



(ここで、R³、R⁴、R⁶及びR⁷は、独立してヒドロキシル、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択され；

R⁵及びR⁹は、独立して水素、メチル、ヒドロキシメチル、アセトアミドメチル、カルボキシル、及びX-(CH₂)_r-からなる群から選択され、ここでXは糖質部分であり、rは0、1、2及び3から選択される整数であり；及び

R⁸及びR¹⁰は、独立してヒドロキシル、C₁₋₆-アルコキシ、C₁₋₆-アシリオキシ、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択される；)

から選択されるオリゴ糖の環状カルバメート、及びそれらの薬学的に許容される塩。