

【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 0 7 K 14/705 (2006.01)

C 0 7 K 1/02 (2006.01)

C 0 7 K 14/00 (2006.01)

C 0 7 K 14/62 (2006.01)

C 0 7 K 14/765 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

G 0 1 N 33/48 (2006.01)

G 0 1 N 33/50 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 14/705

C 0 7 K 1/02

C 0 7 K 14/00

C 0 7 K 14/62

C 0 7 K 14/765

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 37/26

A 6 1 P 43/00 1 0 5

G 0 1 N 33/48 A

G 0 1 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

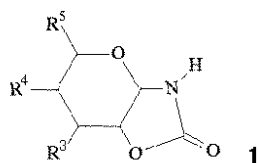
【補正の内容】

【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って、該方法が、環状カルバメート ( 1 )

【化 1】



(ここで、 $R^3$  及び  $R^4$  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、 $R^5$  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  $X - (CH_2)_r -$  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、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、 $\text{pH } 6.5 - 10.5$  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。

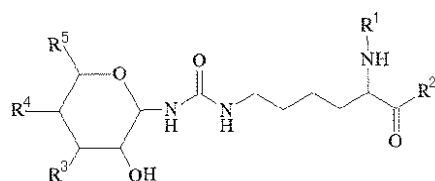
【請求項 6】

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】



一般式 1

(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あって、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；

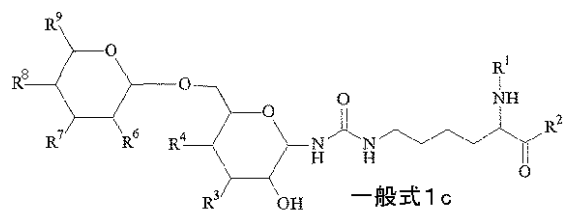
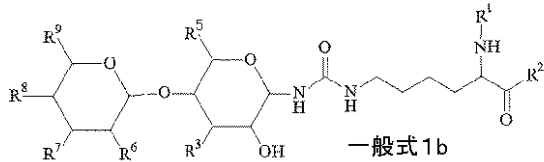
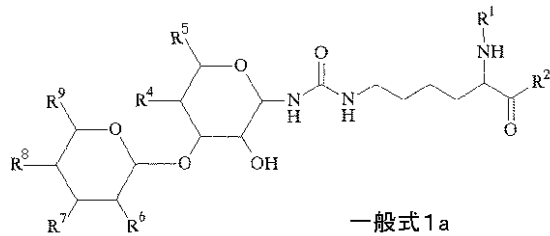
$R^5$  は、水素、メチル、ヒドロキシメチル、アセトアミドメチル、カルボキシル、及び  $X - (CH_2)_r -$  からなる群から選択され、ここで、 $X$  は糖質部分であり、 $r$  は 0 及び 1 から選択される整数である；)

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】

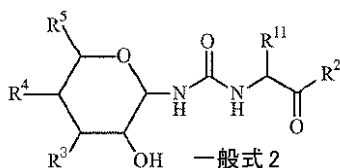


(ここで、 $R^6$  及び  $R^7$  は請求項 1 に記載の  $R^3$  及び  $R^4$  の定義と同一であり、 $R^9$  は請求項 1 に記載の  $R^5$  の定義と同一であり、 $R^8$  はヒドロキシル、 $C_{1-6}$ -アルコキシ、 $C_{2-20}$ -アシルオキシ、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択される。) のいずれか 1 つ以上の部分を含む、請求項 7 記載の糖質 - ペプチド複合体。

## 【請求項 9】

一般式 2 :

## 【化 4】

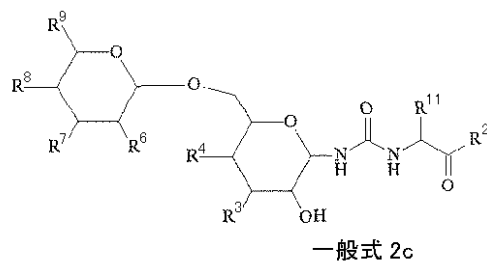
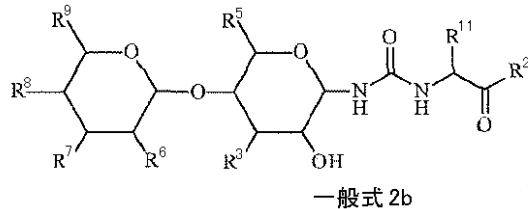
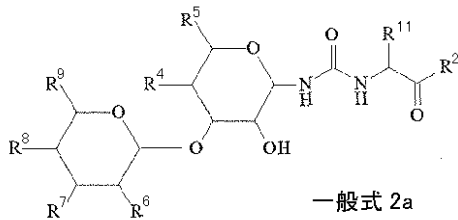


(ここで、  
 $R^{11}$  はアミノ酸側鎖；  
 $R^2$  は  $-NH-CH(R^{11})-C(=O)-$  と一緒になって、合計のアミノ酸が少なくとも 30 のペプチド部分を表し；  
 $R^3$  及び  $R^4$  は、独立して、ヒドロキシル、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択され；  
 $R^5$  は、水素、メチル、ヒドロキシメチル、アセトアミドメチル、カルボキシル、及び  $X-(CH_2)_r-$  からなる群から選択され、ここで  $X$  は糖質部分であり、 $r$  は 0、1、2 及び 3 から選択される整数である；)  
 の 1 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 2 a、2 b、及び 2 c

## 【化 5】



(ここで、 $R^6$  及び  $R^7$  は、請求項 1 に記載の  $R^3$  及び  $R^4$  の定義と同一であり、 $R^9$  は請求項 1 に記載の  $R^5$  の定義と同一であり、及び  $R^8$  は、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ -アルコキシ、 $C_{2-20}$ -アシルオキシ、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。

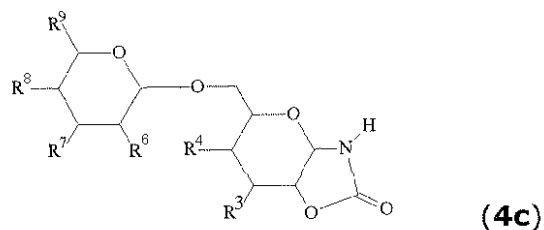
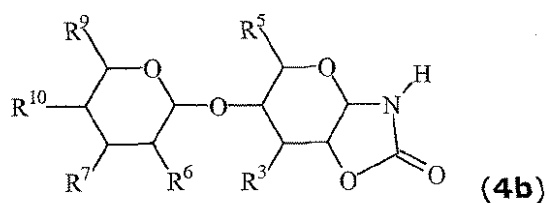
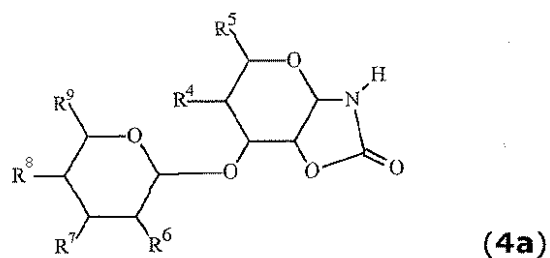
## 【請求項 17】

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、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$  及び  $R^7$  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；

$R^5$  及び  $R^9$  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  $X - (CH_2)_r -$  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、1、2 及び 3 から選択される整数であり；及び

$R^8$  及び  $R^{10}$  は、独立してヒドロキシル、 $C_{1-6}$ -アルコキシ、 $C_{1-6}$ -アシルオキシ、アセトアミド、及び糖質部分からなる群から選択される；)

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。