

【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】令和 1 年 12 月 26 日 (2019.12.26)

【公表番号】特表 2019-501141 (P2019-501141A)

【公表日】平成 31 年 1 月 17 日 (2019.1.17)

【年通号数】公開・登録公報 2019-002

【出願番号】特願 2018-527804 (P2018-527804)

【国際特許分類】

C 0 7 K 14/195 (2006.01)

A 6 1 K 47/66 (2017.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/704 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

C 1 2 N 15/62 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 14/195 Z N A

A 6 1 K 47/66

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/704

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

C 1 2 N 15/62

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 11 月 13 日 (2019.11.13)

【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】

式 (X)

G V R A K A G V R N (N l e) F K S E S Y (X) (配列番号 1 0)

の化合物と少なくとも 8 0 % の配列同一性を有し、

少なくとも 1 つの保護基および / または少なくとも 1 つの標識剤が、N 末端および / または C 末端において前記ペプチド化合物に連結されていて、

V a c u o l a r P r o t e i n S o r t i n g 1 0 (V p s 1 0) ファミリー受容体に結合する、

ペプチド化合物。

【請求項 2】

式 (X)

G V R A K A G V R N (N l e) F K S E S Y (X) (配列番号 1 0)

の化合物と少なくとも 8 0 % の配列同一性を有し、

V a c u o l a r P r o t e i n S o r t i n g 1 0 タンパク質 (V p s 1 0) ファミリー受容体に結合する、

ペプチド化合物。

【請求項 3】

式 (X) の化合物と少なくとも 88% の配列同一性を有する、請求項 1 又は 2 に記載のペプチド化合物。

【請求項 4】

式 (X) の化合物と少なくとも 94% の配列同一性を有する、請求項 1 又は 2 に記載のペプチド化合物。

【請求項 5】

N 末端において連結されている少なくとも 1 つの保護基を含む、請求項 1 に記載のペプチド化合物。

【請求項 6】

少なくとも 1 つの保護基としてアセチル又はスクシニルを含む、請求項 1 又は 5 に記載のペプチド化合物。

【請求項 7】

アミノ酸配列として配列番号 10 の配列を含む、請求項 1 又は 2 に記載のペプチド化合物。

【請求項 8】

式 (X) により表され配列番号 10 のアミノ酸配列からなる、請求項 1 に記載のペプチド化合物。

【請求項 9】

式 (X)

G V R A K A G V R N (N l e) F K S E S Y (X) (配列番号 10)

からなる、ペプチド化合物。

【請求項 10】

式 A - (B)_n のコンジュゲート化合物：

(式中、

n は 1、2、3 または 4 であり、

A は、保護基によって保護されている請求項 1 から 9 のいずれかに記載のペプチド化合物であり、および

B は、少なくとも 1 つの治療剤であって、A に連結されていて、前記ペプチド化合物の遊離アミンにおいて、前記ペプチド化合物の N 末端位において、前記ペプチド化合物の遊離 - SH において、または前記ペプチド化合物の遊離カルボキシルにおいて、連結されている)。

【請求項 11】

式 A - (B)_n のコンジュゲート化合物：

(式中、

n は 1、2、3 または 4 であり、

A は、保護基によって保護されている請求項 1 から 9 のいずれかに記載のペプチド化合物であり、および

B は、少なくとも 1 つの治療剤であって、A に連結されていて、前記ペプチド化合物のリジン残基の遊離アミンにおいてリンカーを介して、または前記ペプチド化合物の N 末端位において、リンカーを介して、連結されている)。

【請求項 12】

式 A - (B)_n のコンジュゲート化合物：

(式中、

n は 1、2、3 または 4 であり、

A は、請求項 1 から 9 のいずれか 1 項に記載のペプチド化合物であり、および

B は、少なくとも 1 つの治療剤であって、A に連結されている)。

【請求項 13】

式 A - (B)_n のコンジュゲート化合物：

(式中、

n は 1、2、3 または 4 であり、

A は、請求項 1 から 9 のいずれか 1 項に記載のペプチド化合物であり、および

B は、少なくとも 1 つの治療剤であって、A に連結されていて、前記ペプチド化合物のリジン残基の遊離アミンにおいて、または前記ペプチド化合物の N 末端位において、連結されている。

【請求項 14】

B が、リンカーを介して A に連結されている、請求項 10、12 又は 13 に記載のコンジュゲート化合物。

【請求項 15】

少なくとも 1 つの治療剤が抗癌剤である、請求項 10 から 14 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物。

【請求項 16】

抗癌剤が、ドセタキセル、カバジタキセル、パクリタキセル、ドキソルビシンまたはダウノマイシンである、請求項 15 に記載のコンジュゲート化合物。

【請求項 17】

前記抗癌剤がドセタキセルである、請求項 16 に記載のコンジュゲート化合物。

【請求項 18】

式 (X V I I) の化合物である、請求項 10 から 13 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物：

G V R A K (ドセタキセル) A G V R N (N l e) F K (ドセタキセル) S E S Y (X V I I)

(配列番号 10 の配列を有し、各リジン残基にドセタキセル分子が連結されているペプチド化合物を含む)。

【請求項 19】

式 (X X I) の化合物である、請求項 10 から 13 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物：

アセチル - G V R A K (ドセタキセル) A G V R N (N l e) F K (ドセタキセル) S E S Y (X X I)

(配列番号 15 の配列を有し、各リジン残基にドセタキセル分子が連結されているペプチド化合物を含む)。

【請求項 20】

前記抗癌剤がドキソルビシンである、請求項 15 に記載のコンジュゲート化合物。

【請求項 21】

式 (X X I V) の化合物である、請求項 10 から 13 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物：

G V R A K (ドキソルビシン) A G V R N (N l e) F K (ドキソルビシン) S E S Y (X X I V)

(配列番号 10 を有し、各リジン残基にドキソルビシン分子が連結されているペプチド化合物を含む)。

【請求項 22】

式 (X X V I) の化合物である、請求項 10 から 13 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物：

アセチル - G V R A K (ドキソルビシン) A G V R N (N l e) F K (ドキソルビシン) S E S Y (X X V I)

(配列番号 15 を有し、各リジン残基にドキソルビシン分子が連結されているペプチド化合物を含む)。

【請求項 23】

式 (X X X I V) の化合物である、請求項 10 から 13 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物：

G V R A K (クルクミン) A G V R N (N l e) F K (クルクミン) S E S Y (X X X I V)

(配列番号 10 を有し、各リジン残基にクルクミン分子が連結されているペプチド化合物を含む)。

【請求項 24】

式 (X X X V) の化合物である、請求項 10 から 13 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物：

アセチル - G V R A K (クルクミン) A G V R N (N l e) F K (クルクミン) S E S Y (X X X V)

(配列番号 15 を有し、各リジン残基にクルクミン分子が連結されているペプチド化合物を含む)。

【請求項 25】

B が、前記ペプチド化合物の前記リジン残基の前記遊離アミンにおいて、リンカーを介して A に連結されている、請求項 10 から 24 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物。

【請求項 26】

B が、前記ペプチド化合物の前記 N 末端位において、リンカーを介して A に連結されている、請求項 10 から 17 及び 20 のいずれかに記載のコンジュゲート化合物。

【請求項 27】

リンカーが、コハク酸およびジメチルグルタル酸から なる群から 選択される、請求項 25 または 26 に記載のコンジュゲート化合物。

【請求項 28】

ソルチリン発現を伴う疾患を治療するための、請求項 1 から 27 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物の使用。

【請求項 29】

V a c u o l a r P r o t e i n S o r t i n g 10 (V p s 10) ファミリー受容体から選択される少なくとも 1 つの受容体の発現を伴う疾患を治療するための、請求項 1 から 27 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物の使用。

【請求項 30】

少なくとも 1 つの受容体がソルチリン、S o r L 1、S o r C S 1、S o r C S 2、および S o r C S 3 から選択される、請求項 29 に記載の使用。

【請求項 31】

V a c u o l a r P r o t e i n S o r t i n g 10 (V p s 10) ファミリー受容体から選択される少なくとも 1 つの受容体の発現を伴う癌を治療するための、請求項 1 から 27 のいずれかに記載の使用。

【請求項 32】

癌が、卵巣癌、脳癌、乳癌、メラノーマ、結腸直腸癌、膠芽細胞腫、肝臓癌、肺癌、前立腺癌、子宮頸癌、頭部癌、胃癌、腎臓癌、子宮内膜癌、精巣癌、尿路上皮癌、急性リンパ芽球性白血病、急性骨髄性白血病、ホジキンリンパ腫、神経芽細胞腫、非ホジキンリンパ腫、軟部組織癌、骨肉腫、甲状腺癌、移行細胞膀胱癌、ウィルムス腫瘍、神経膠腫、膵臓癌または脾臓癌である、請求項 31 に記載の使用。

【請求項 33】

癌が乳癌である、請求項 32 に記載の使用。

【請求項 34】

請求項 1 から 27 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物を含む、リボソーム、グラフェンまたはナノ粒子。

【請求項 35】

治療剤および s i R N A の少なくとも 1 つが 担持 されたリボソーム、グラフェンまたはナノ粒子であって、請求項 1 から 9 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物でコーティングされている リボソーム、グラフェンまたはナノ粒子。