

【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】令和2年11月12日(2020.11.12)

【公開番号】特開2020-252(P2020-252A)

【公開日】令和2年1月9日(2020.1.9)

【年通号数】公開・登録公報2020-001

【出願番号】特願2019-165052(P2019-165052)

【国際特許分類】

C 1 2 N	15/13	(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	16/18	(2006.01)
C 0 7 K	16/46	(2006.01)
C 1 2 P	21/08	(2006.01)
C 1 2 N	15/63	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/62	(2017.01)
A 6 1 K	47/61	(2017.01)
A 6 1 K	47/68	(2017.01)

【F I】

C 1 2 N	15/13	Z N A
C 1 2 N	1/15	
C 1 2 N	1/19	
C 1 2 N	1/21	
C 1 2 N	5/10	
C 0 7 K	16/18	
C 0 7 K	16/46	
C 1 2 P	21/08	
C 1 2 N	15/63	Z
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 K	47/62	
A 6 1 K	47/61	
A 6 1 K	47/68	

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月5日(2020.10.5)

【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】

少なくとも1つの式(I V)：

- Gal - Sia - C (H) = N - Q - CON - X (I V)

[式中、

- A) Qは、N HまたはOであり、
- B) C O Nは、接続部分であり、
- C) Xは、診断用または治療用のエフェクター部分であり、
- D) G a lは、ガラクトース部分であり、
- E) S i aは、シアル酸部分である]

部分を含む、少なくとも1つのグリカンを含む結合性ポリペプチド。

【請求項2】

グリカンは二分岐グリカンである、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項3】

二分岐グリカンは、フコシル化されており、または非フコシル化である、請求項2に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項4】

グリカンは、少なくとも2つの式(I V)部分を含む、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項5】

グリカンは、結合性ポリペプチドに対してN結合している、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項6】

結合性ポリペプチドはFcドメインを含む、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項7】

グリカンは、EUナンバリングによるFcドメインのアミノ酸297位のアスパラギン残基を介して結合性ポリペプチドに対してN結合している、請求項6に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項8】

グリカンは、EUナンバリングによるFcドメインのアミノ酸298位のアスパラギン残基を介して結合性ポリペプチドに対してN結合している、請求項6に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項9】

Fcドメインはヒトである、請求項6に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項10】

結合性ポリペプチドはCH1ドメインを含む、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項11】

グリカンは、KabatナンバリングによるCH1ドメインのアミノ酸114位のアスパラギン残基を介して結合性ポリペプチドに対してN結合している、請求項10に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項12】

診断用または治療用のエフェクター部分は検出剤である、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項13】

診断用または治療用のエフェクター部分は標的化部分である、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項14】

標的化部分は炭水化物または糖ペプチドである、請求項13に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項15】

標的化部分はグリカンである、請求項13に記載の結合性ポリペプチド。

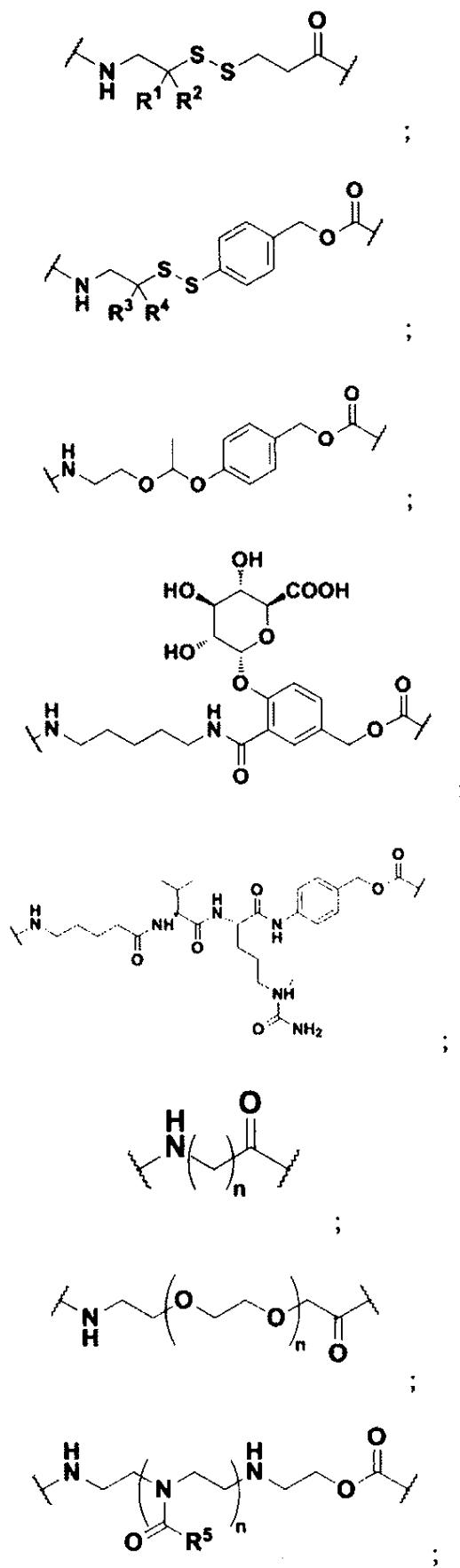
【請求項16】

接続部分は、pH感受性のリンカー、ジスルフィドリンカー、酵素感受性のリンカー、または他の切断可能なリンカー部分を含む、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

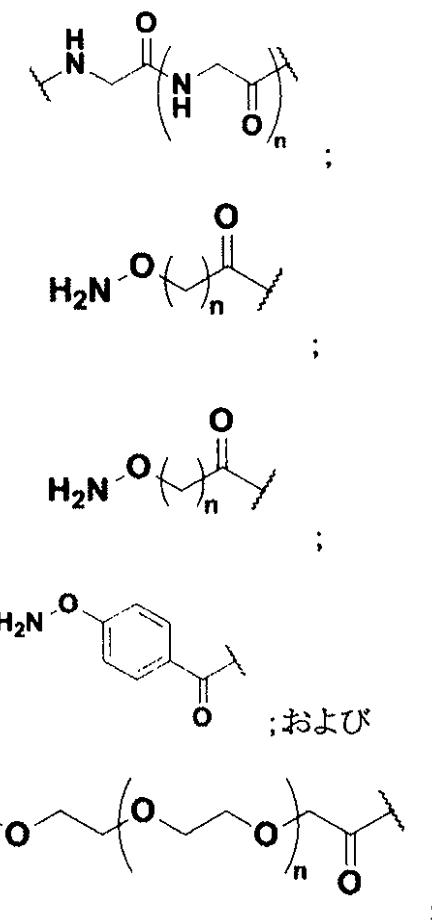
【請求項 1 7】

接続部分は、以下：

【化 1】



【化 2】



(ここで、R¹～R⁵は、それぞれ独立して、H、アルキル部分またはアリール部分からなる群から選択される)

からなる群から選択されるリンカー部分を含む、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項18】

抗体またはイムノアドヘシンである、請求項1に記載の結合性ポリペプチド。

【請求項19】

請求項1～18のいずれか1項に記載の結合性ポリペプチド、および薬学的に許容される担体または賦形剤を含む、組成物。

【請求項20】

診断用または治療用のエフェクター部分の、結合性ポリペプチドに対する比率は4未満である、請求項19に記載の組成物。

【請求項21】

診断用または治療用のエフェクター部分の、結合性ポリペプチドに対する比率は約2である、請求項20に記載の組成物。

【請求項22】

有効量の請求項19～21のいずれか1項に記載の組成物を投与することを含む、それを必要とする患者を処置する方法。

【請求項23】

請求項1～18のいずれか1項に記載の結合性ポリペプチドをコードする、単離されたポリヌクレオチド。

【請求項24】

請求項23に記載のポリヌクレオチドを含むベクター。

【請求項25】

請求項 2 3 に記載のポリヌクレオチドまたは請求項 2 4 に記載のベクターを含む宿主細胞。

【請求項 2 6】

請求項 1 に記載の結合性ポリペプチドを作製する方法であって、式 (I) :



[式中、

- A) Q は、 NH または O であり、
- B) C O N は、 接続部分であり、
- C) X は、 診断用または治療用のエフェクター部分である]

のエフェクター部分を、 酸化されたグリカンを含む結合性ポリペプチドと反応させることを含む、 前記方法。

【請求項 2 7】

酸化されたグリカンを含む結合性ポリペプチドは、 グリカンを含む結合性ポリペプチドを、 穏やかな酸化剤と反応させることによって產生される、 請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 2 8】

穏やかな酸化剤は、 過ヨウ素酸ナトリウムである、 請求項 2 7 に記載の方法。

【請求項 2 9】

1 mM 未満の過ヨウ素酸ナトリウムを用いる、 請求項 2 8 に記載の方法。

【請求項 3 0】

穏やかな酸化剤はガラクトースオキシダーゼである、 請求項 2 7 に記載の方法。

【請求項 3 1】

グリカンを含む結合性ポリペプチドは、 1 つまたは 2 つの末端シアル酸残基を含む、 請求項 2 6 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 3 2】

末端シアル酸残基は、 結合性ポリペプチドを、 シアリルトランスフェラーゼ、 またはシアリルトランスフェラーゼとガラクトシリトランスフェラーゼとの組合せで処理することにより導入される、 請求項 3 1 に記載の方法。