

【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5年11月14日(2023.11.14)

【国際公開番号】WO2021/091986

【公表番号】特表2022-554272(P2022-554272A)

【公表日】令和4年12月28日(2022.12.28)

【年通号数】公開公報(特許)2022-240

【出願番号】特願2022-525246(P2022-525246)

【国際特許分類】

A 6 1 K 4 7 / 6 0 (2 0 1 7 . 0 1)

C 0 7 K 1 4 / 5 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 8 / 2 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

A 6 1 K 4 7 / 6 0

C 0 7 K 1 4 / 5 4 Z N A

A 6 1 K 3 8 / 2 0

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 4

20

【手続補正書】

【提出日】令和5年11月6日(2023.11.6)

【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】

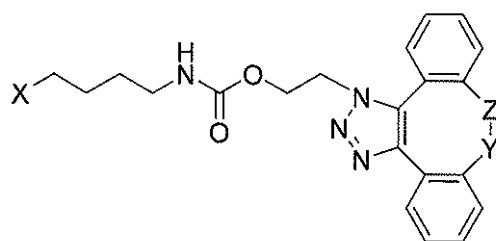
【特許請求の範囲】

30

【請求項1】

配列番号1のアミノ酸配列を含むIL-10コンジュゲートであって、該IL-10コンジュゲート中の少なくとも1個のアミノ酸残基が、式(I)：

【化1】



40

(I)

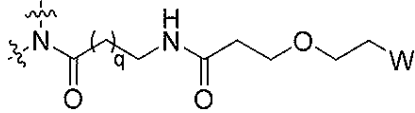
(式中、

式(I)の構造の位置は、N82、K88、A89、K99、K125、N126、N129、およびK130から選択され、

Zは、CH₂であり、Yは、

50

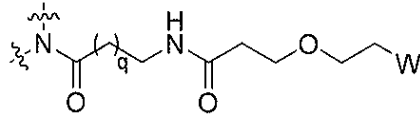
【化2】



であるか、

Yは、 CH_2 であり、Zは、

【化3】

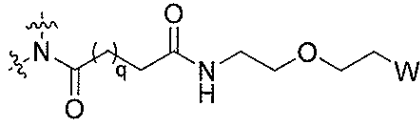


10

であるか、

Zは、 CH_2 であり、Yは、

【化4】

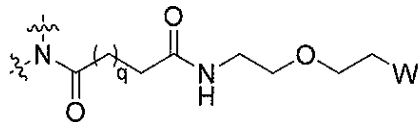


20

であるか；または

Yは、 CH_2 であり、Zは、

【化5】



30

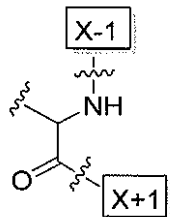
であり；

Wは、約5 kDa、10 kDa、15 kDa、20 kDa、25 kDa、30 kDa、35 kDa、40 kDa、45 kDa、50 kDa、および60 kDaから選択される分子量を有するPEG基であり；

qは、1、2、または3であり；

Xは、構造：

【化6】



40

を有し；

X - 1は、前のアミノ酸残基への結合点を示し；

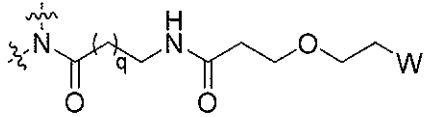
X + 1は、次のアミノ酸残基への結合点を示す）

の構造によって置き換えられる、前記IL-10コンジュゲート。

【請求項2】

50

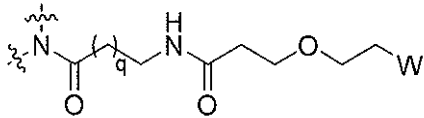
ZはCH₂であり、Yは、
【化7】



である、請求項1に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項3】

YはCH₂であり、Zは、
【化8】

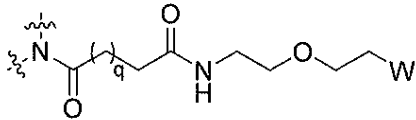


10

である、請求項1に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項4】

ZはCH₂であり、Yは、
【化9】

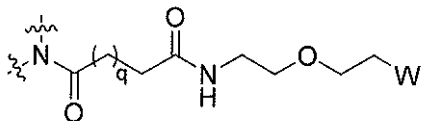


20

である、請求項1に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項5】

YはCH₂であり、Zは、
【化10】



30

である、請求項1に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項6】

PEG基は、約5kDa、10kDa、20kDaおよび30kDaから選択される分子量を有する、請求項1～5のいずれか1項に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項7】

PEG基は、約10kDaおよび20kDaから選択される分子量を有する、請求項6に記載のIL-10コンジュゲート。

40

【請求項8】

式(I)の構造の位置は、N82、K99、N129、およびK130から選択される、請求項1～7のいずれか1項に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項9】

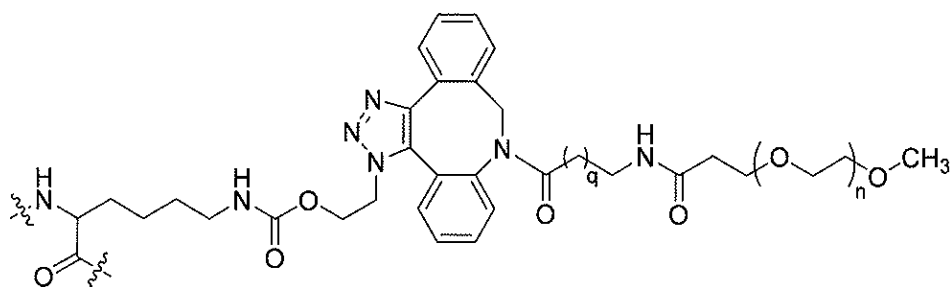
式(I)の構造の位置は、N82およびN129から選択される、請求項8に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項10】

式(I)の構造は、式(X)または式(XI)の構造を有する：

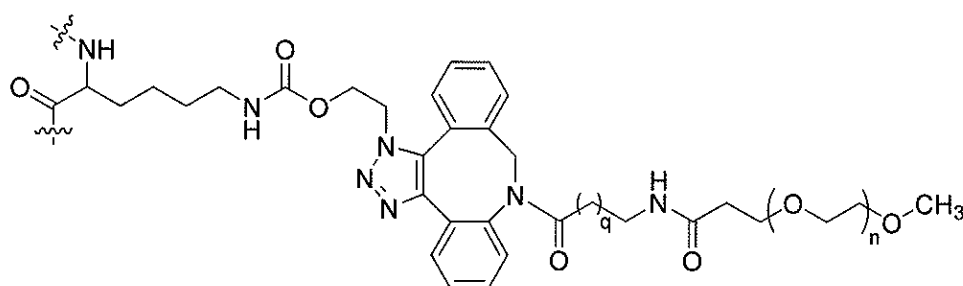
50

【化 1 1】



(X)

10



(XI)

20

(式中、

q は、1、2、または3であり；

n は、約2～約5000の範囲の整数であり；

波線は、置き換えられない配列番号1内のアミノ酸残基への共有結合を示す)

請求項1に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項11】

配列番号1中の式(X)または式(XI)の構造の位置は、N82、K99、N129、およびK130から選択される、請求項10に記載のIL-10コンジュゲート。 30

【請求項12】

配列番号1中の式(X)または式(XI)の構造の位置は、N82およびN129から選択される、請求項11に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項13】

nは、 $-(OCH_2CH_2)_n-OCH_3$ が約10kDaまたは20kDaの分子量を有するような整数である、請求項10～12のいずれか1項に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項14】

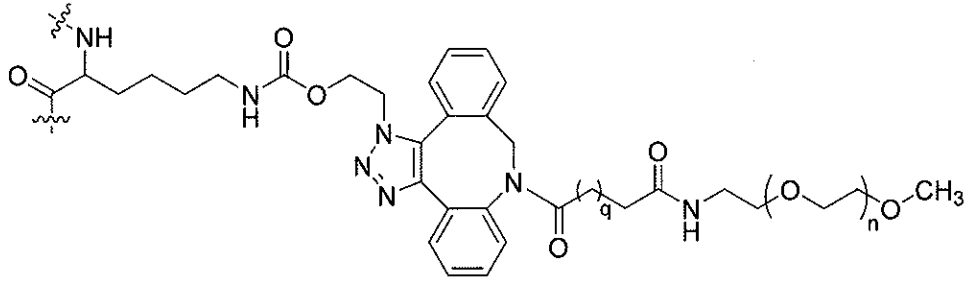
請求項10～13のいずれか1項に記載のIL-10コンジュゲートの混合物を含む医薬組成物であって、該混合物は、式(I)の構造が式(X)の構造を有するIL-10コンジュゲートおよび式(I)の構造が式(XI)の構造を有するIL-10コンジュゲートを含む、前記医薬組成物。 40

【請求項15】

式(I)の構造は、式(XII)または式(XIII)の構造を有する：

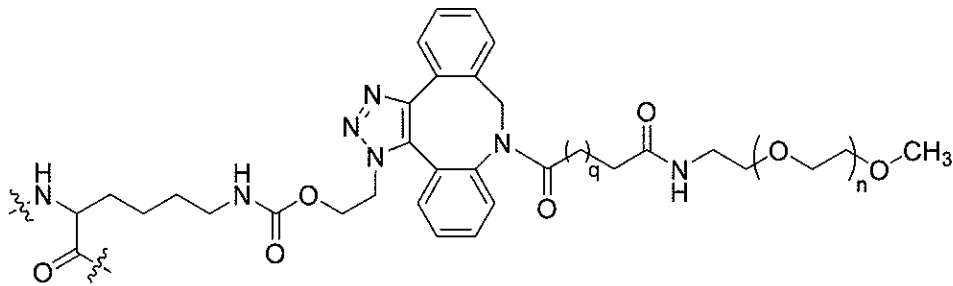
50

【化 1 2】



(XII)

10



(XIII)

20

(式中、

q は、1、2、または3であり；

n は、約2～約5000の範囲の整数であり；

波線は、置き換えられない配列番号1内のアミノ酸残基への共有結合を示す)

請求項1に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項16】

配列番号1中の式(XII)または式(XIII)の構造の位置は、N82、K99、N129、およびK130から選択される、請求項15に記載のIL-10コンジュゲート。

30

【請求項17】

配列番号1中の式(XII)または式(XIII)の構造の位置は、N82およびN129から選択される、請求項15または16に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項18】

n は、 $-(OCH_2CH_2)_n-OCH_3$ が、約10kDaまたは20kDaの分子量を有するような整数である、請求項15～17のいずれか1項に記載のIL-10コンジュゲート。

【請求項19】

請求項15～18のいずれか1項に記載のIL-10コンジュゲートの混合物を含む医薬組成物であって、該混合物は、式(I)の構造が式(XII)の構造を有するIL-10コンジュゲートおよび式(I)の構造が式(XIII)の構造を有するIL-10コンジュゲートを含む、前記医薬組成物。

40

【請求項20】

q は1である、請求項1～19のいずれか1項に記載のIL-10コンジュゲートまたは医薬組成物。

【請求項21】

q は2である、請求項1～19のいずれか1項に記載のIL-10コンジュゲートまたは医薬組成物。

50

【請求項 2 2】

q は 3 である、請求項 1 ~ 1 9 のいずれか 1 項に記載の I L - 1 0 コンジュゲートまたは医薬組成物。

【請求項 2 3】

薬学的に許容される塩、溶媒和物、または水和物である、請求項 1 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の I L - 1 0 コンジュゲート。

【請求項 2 4】

それを必要とする対象におけるがんを処置する方法に使用するための、有効量の請求項 1 ~ 1 3、1 5 ~ 1 8 および 2 0 ~ 2 3 のいずれか 1 項に記載の I L - 1 0 コンジュゲートを含む医薬組成物。

10

【請求項 2 5】

がんは、腎細胞癌 (R C C)、非小細胞肺癌 (N S C L C)、頭頸部扁平上皮がん (H N S C C)、古典的ホジキンリンパ腫 (c H L)、縦隔原発大細胞型 B 細胞リンパ腫 (P M B C L)、尿路上皮癌、マイクロサテライト不安定がん、マイクロサテライト安定性がん、マイクロサテライト安定性結腸直腸がん、胃がん、子宮頸がん、肝細胞癌 (H C C)、メルケル細胞癌 (M C C)、黒色腫、小細胞肺癌 (S C L C)、食道がん、グリア芽腫、中皮腫、乳がん、トリプルネガティブ乳がん、前立腺がん、膀胱がん、卵巣がん、中程度から低い遺伝子変異量の腫瘍、皮膚扁平上皮癌 (C S C C)、扁平上皮皮膚がん (S C S C)、P D - L 1 低発現から非発現性の腫瘍、原発解剖学的発生部位を超えて肝臓および C N S に全身的に播種した腫瘍、およびびまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫から選択される、請求項 2 4 に記載の医薬組成物。

20

【請求項 2 6】

I L - 1 0 コンジュゲートは、1 日 1 回、1 日 2 回、1 日 3 回、週 1 回、2 週に 1 回、3 週に 1 回、4 週に 1 回、5 週に 1 回、6 週に 1 回、7 週に 1 回、または 8 週に 1 回、対象に投与されることになっている、請求項 2 4 または 2 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

I L - 1 0 コンジュゲートは、静脈内投与によって対象に投与されることになっている、請求項 2 4 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

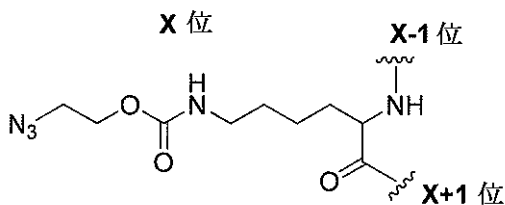
【請求項 2 8】

I L - 1 0 コンジュゲートを作製する方法であって、

30

式：

【化 1 3】



(式中、I L - 1 0 ポリペプチドは、I L - 1 0 ポリペプチド中の少なくとも 1 個のアミノ酸残基は、非天然アミノ酸によって置き換えられた配列番号 1 のアミノ酸配列を含み、X - 1 位は、前のアミノ酸残基への結合点を示し、X + 1 位は、次のアミノ酸残基への結合点を示し、X 位は、非天然アミノ酸が置換するアミノ酸の位置を示す)

40

の非天然アミノ酸を含む I L - 1 0 ポリペプチドと、

式：

50

