

【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 27 年 8 月 13 日 (2015.8.13)

【公表番号】特表 2014-521661 (P2014-521661A)
 【公表日】平成 26 年 8 月 28 日 (2014.8.28)
 【年通号数】公開・登録公報 2014-046
 【出願番号】特願 2014-523099 (P2014-523099)
 【国際特許分類】

C 0 7 K 14/00 (2006.01)
 C 1 2 N 9/48 (2006.01)
 C 1 2 Q 1/00 (2006.01)
 A 6 1 K 49/04 (2006.01)
 C 0 7 K 1/13 (2006.01)

【F I】

C 0 7 K 14/00
 C 1 2 N 9/48 Z N A
 C 1 2 Q 1/00 C
 A 6 1 K 49/04 A
 C 0 7 K 1/13

【手続補正書】
 【提出日】平成 27 年 6 月 22 日 (2015.6.22)
 【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】
 以下の構造を有する式 I の選択的な送達分子であって；
 【化 1】



式 I

式中、

X は、マトリックスメタロプロテアーゼによって開裂可能なペプチドリンカーであり；
 A は、5 の連続するグルタミン酸を含む配列を有するペプチドであり；
 B は、8 の連続するアルギニンを含む配列を有するペプチドであり；
 c_A 、 c_B 、及び c_M は各々独立して、アミノ酸であり；
 M はポリエチレングリコール (PEG) ポリマーであり；及び
 D_A 及び D_B は、他のものと共にフォースター / 蛍光共鳴エネルギー転移を受けることができる、1 対のアクセプター及びドナーの蛍光部分であり；及び
 ここで、 $[c_M - M]$ は、A 又は X 上の任意の位置にて結合され、 $[D_A - c_A]$ は、A 上の任意のアミノ酸に結合され、 $[c_B - D_B]$ は、B 上の任意のアミノ酸に結合されることを特徴とする、分子。

【請求項 2】

c_A 、 c_B 、及び c_M は各々独立して、D - シス테인、D - グルタミン酸、リジン、及び para - 4 - アセチル L - フェニルアラニンから選択されることを特徴とする、請

求項 1 に記載の分子。

【請求項 3】

X は、P L G L A G、P L G - C (m e) - A G、及び R P L A L W R S から選択されるアミノ酸配列を含むことを特徴とする、請求項 1 に記載の分子。

【請求項 4】

D_A 及び D_B は、C y 5 と C y 7、C y 5 と I R D y e 7 5 0、C y 5 と I R D y e 8 0 0、又は C y 5 と I C G であることを特徴とする、請求項 1 に記載の分子。

【請求項 5】

D_A 及び D_B は、C y 5 と C y 7 であることを特徴とする、請求項 4 に記載の分子。

【請求項 6】

M は、5 0 0 D a、1 k D a、2 k D a、5 k D a、1 0 k D a、2 0 k D a、又は 4 0 k D a の平均分子量を持つ多分散 P E G ポリマーであることを特徴とする、請求項 1 に記載の分子。

【請求項 7】

式 I の分子が以下の構造を有することを特徴とする、請求項 1 に記載の分子。

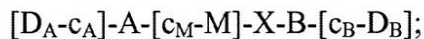
【化 2】



【請求項 8】

必要とする個体における対象の組織を視覚化するための製品の製造における式 I の分子の使用であって、該使用は：

a . 個体における対象の組織に局在化する式 I の分子を個体に投与する工程であって、
【化 3】



式 I

式中、

X は、マトリックスメタロプロテアーゼによって開裂可能なペプチドリinkerであり

;

A は、5 の連続するグルタミン酸を含む配列を有するペプチドであり；

B は、8 の連続するアルギニンを含む配列を有するペプチドであり；

c_A 、 c_B 、及び c_M は各々独立して、アミノ酸であり；

M はポリエチレングリコール (P E G) ポリマーであり；及び

D_A 及び D_B は、他のものと共にフォースター / 蛍光共鳴エネルギー転移を受けることができる、1 対のアクセプター及びドナーの蛍光部分であり；及び

ここで、 $[c_M - M]$ は、A 又は X 上の任意の位置にて結合され、 $[D_A - c_A]$ は、A 上の任意のアミノ酸に結合され、 $[c_B - D_B]$ は、B 上の任意のアミノ酸に結合される、工程；及び

b . 造影剤の少なくとも 1 つを視覚化する工程
を含むことを特徴とする、使用。

【請求項 9】

組織は癌組織であることを特徴とする、請求項 8 に記載の使用。

【請求項 10】

癌組織は、乳癌組織、結腸直腸癌組織、扁平上皮癌組織、前立腺癌組織、黒色腫組織、又は甲状腺癌組織であることを特徴とする、請求項 9 に記載の使用。

【請求項 11】

個体から対象の組織を外科的に除去する工程を更に含むことを特徴とする、請求項 8 に記載の使用。

【請求項 12】

対象の組織を囲む外科的縁は減らされることを特徴とする、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 13】

c_A 、 c_B 、及び c_M は各々独立して、D - システイン、D - グルタミン酸、リジン、及び p a r a - 4 - アセチル L - フェニルアラニンから選択されることを特徴とする、請求項 8 に記載の使用。

【請求項 14】

X は、P L G L A G、P L G - C (m e) - A G、及び R P L A L W R S から選択されるアミノ酸配列を含むことを特徴とする、請求項 8 に記載の使用。

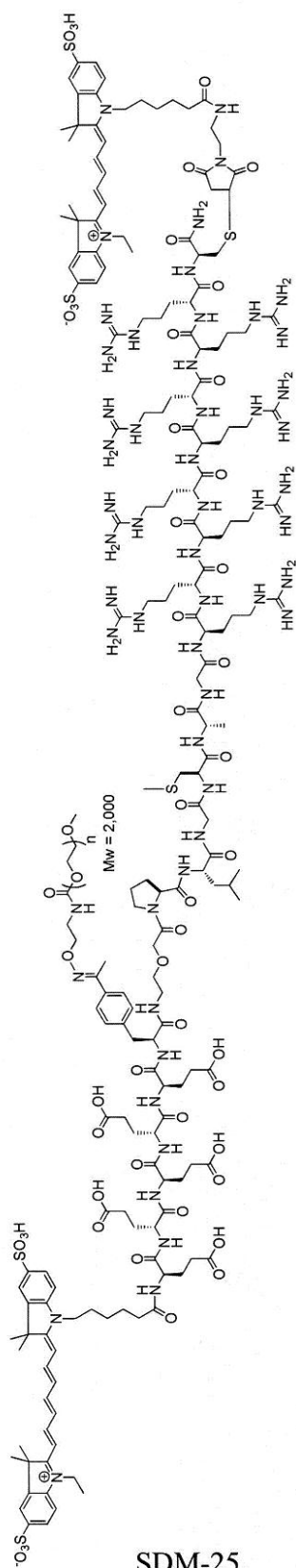
【請求項 15】

D_A 及び D_B は、C y 5 と C y 7、C y 5 と I R D y e 7 5 0、C y 5 と I R D y e 8 0 0、又は C y 5 と I C G であることを特徴とする、請求項 8 に記載の使用。

【請求項 16】

式 I の分子が以下の構造を有することを特徴とする、請求項 8 に記載の使用。

【化 4】



SDM-25.