【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10月24日(2019.10.24)

【公表番号】特表2018-532722(P2018-532722A)
【公表日】平成30年11月8日(2018.11.8)
【年通号数】公開・登録公報2018-043
【出願番号】特願2018-514285(P2018-514285)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｋ　14/415　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/02　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　39/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/43　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/50　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/44　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　3/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　19/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　29/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　17/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　27/02　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/28　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/39　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　37/08　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　37/06　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/54　(2017.01)
Ａ６１Ｋ　47/59　(2017.01)
Ａ６１Ｋ　38/36　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　38/37　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　14/47　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｋ　14/415　ＺＮＡ
Ａ６１Ｋ　38/02
Ａ６１Ｋ　39/00　Ｈ
Ａ６１Ｋ　38/43
Ａ６１Ｋ　38/50
Ａ６１Ｋ　38/44
Ａ６１Ｐ　3/10
Ａ６１Ｐ　25/00
Ａ６１Ｐ　19/02
Ａ６１Ｐ　29/00　１０１
Ａ６１Ｐ　17/00
Ａ６１Ｐ　27/02
Ａ６１Ｋ　38/28
Ａ６１Ｋ　38/39
Ａ６１Ｐ　37/08
Ａ６１Ｐ　37/06
Ａ６１Ｋ　47/54
Ａ６１Ｋ　47/59
Ａ６１Ｋ　38/36

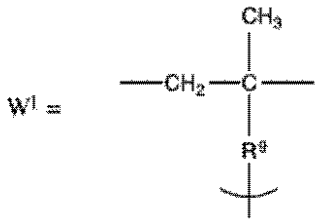
Ａ６１Ｋ　38/37
Ｃ０７Ｋ　14/47

【手続補正書】
【提出日】令和1年9月12日(2019.9.12)
【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】
対象における抗原特異的免疫寛容の誘導のための化合物であって、前記化合物が以下：
抗原：
ポリマー化リンカー：
ここで、ポリマー化リンカーは抗原にジスルフィド結合またはジスルファニルエチルエステルを介して結合され、
ここで、ジスルフィド結合またはジスルファニルエチルエステルは対象への前記化合物の投与の際に切断され、ポリマー化リンカーから前記抗原を開放するようにそれぞれ構成されている、
および
ガラクトシル化またはグルコシル化部分、
を含む、化合物。
【請求項２】
抗原がミエリン塩基性タンパク質、ミエリンオリゴデンドロサイト糖タンパク質およびプロテオリピドタンパク質、および任意の前記抗原の免疫寛容誘導部分の１つ以上を含む、請求項１に記載の化合物。
【請求項３】
抗原がミエリンオリゴデンドロサイト糖タンパク質の少なくとも１つの免疫寛容誘導部分を含む、請求項２に記載の化合物。
【請求項４】
抗原がインスリン、プロインスリン、プレプロインスリン、グルタミン酸デカルボキシラーゼ－６５（ＧＡＤ－６５）、ＧＡＤ－６７、インスリノーマ－関連タンパク質２（ＩＡ－２）、およびインスリノーマ－関連タンパク質２β（ＩＡ－２β）、または任意の前記抗原の免疫寛容誘導部分の１つ以上を含む、請求項１に記載の化合物。
【請求項５】
抗原が高分子量グルテニン、低分子量グルテニン、アルファ－グリアジン、ガンマ－グリアジン、オメガ－グリアジン、ホルデイン、セカリン、アベニン、および任意の前記抗原の免疫寛容誘導部分の１つ以上を含む、請求項１に記載の化合物。
【請求項６】
対象における抗原特異的免疫寛容の誘導のための化合物であって、前記化合物が以下：
寛容が望まれる抗原またはその免疫寛容誘導部分；
ここで、寛容が望まれる抗原は対象に単独で提示された場合、対象における望ましくない免疫応答を誘導できる；
共重合体またはランダム共重合体を含むポリマー化リンカー：
ここで、共重合体またはランダム共重合体は第一のメタクリル酸ユニットおよび第二のメタクリル酸ユニットを含み、ここで第一のメタクリル酸ユニットは第一のエチルアセトアミド官能基を含み、かつ第二のメタクリル酸ユニット第は二のエチルアセトアミド官能基を含む；
ここで、第二のエチルアセトアミド官能基は脂肪族基、アルコールまたは脂肪族アルコー

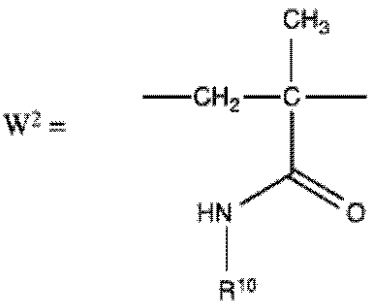
ルにコンジュゲートされている；
ここで、ポリマー化リンカーが寛容は望まれる抗原またはその免疫寛容誘導部分にジスルフィド結合またはジスルファニルエチルエステルを介して結合され、
ここで、ジスルフィド結合またはジスルファニルエチルエステルが対象への前記化合物の投与の際に切断され、ポリマー化リンカーから寛容が望まれる抗原またはその免疫寛容誘導部分を解放するようにそれぞれ構成されている、
および
肝臓標的化部分；
肝臓標的化部分が、ガラクトシル化またはグルコシル化部分を含む；
肝臓標的化部分が第一のエチルアセトアミド官能基を通じてポリマー化リンカーに結合されている
、を含む、化合物。
【請求項７】
ポリマー化リンカーが１－シアノ－１－メチル－プロピル基を含む、請求項６に記載の化合物。
【請求項８】
肝臓標的化部分が、N-アセチルガラクトサミン、ガラクトサミン、ガラクトース、グルコース、グルコサミンまたはＮ－アセチルグルコサミンの１つ以上を含む、請求項６または７に記載の化合物。
【請求項９】
肝臓標的化部分が、N-アセチルガラクトサミンを含む、請求項８に記載の化合物。
【請求項１０】
肝臓標的化部分がベータアノマーである、請求項６－９のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１１】
肝臓標的化部分がそのＣ１、Ｃ２またはＣ６炭素でポリマー化リンカーにコンジュゲートされている、請求項６－１０のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１２】
寛容が望まれる抗原が：
移植抗原；
食物、動物、植物または環境の抗原；
治療薬；
自己抗原；
またはその免疫寛容誘導部分、
を含む、請求項６－１１のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１３】
寛容が望まれる抗原が自己抗原である、請求項６－１２のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項１４】
寛容が望まれる抗原が、多発性硬化症と関連する、請求項１３に記載の化合物。
【請求項１５】
寛容が望まれる抗原がミエリン塩基性タンパク質、ミエリンオリゴデンドロサイト糖タンパク質およびプロテオリピドタンパク質、および任意の前記抗原の免疫寛容誘導部分の１つ以上を含む、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１６】
寛容が望まれる抗原がミエリン塩基性タンパク質の少なくとも１つの免疫寛容誘導部分を含む、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１７】
寛容が望まれる抗原が配列番号：８または配列番号：９のアミノ酸配列を含むポリペプチドを含む、請求項１６に記載の化合物。

【請求項１８】
寛容が望まれる抗原が、ミエリンオリゴデンドロサイト糖タンパク質の少なくとも１つの免疫寛容誘導部分を含む、請求項１４に記載の化合物。
【請求項１９】
寛容が望まれる抗原が配列番号：１１または配列番号：１２のアミノ酸配列を含むポリペプチドを含む、請求項１８に記載の化合物。
【請求項２０】
寛容が望まれる抗原が、Ｉ型糖尿病と関連する、請求項１３に記載の化合物。
【請求項２１】
寛容が望まれる抗原が、インスリン、プロインスリン、プレプロインスリン、グルタミン酸デカルボキシラーゼ－６５（ＧＡＤ－６５）、ＧＡＤ－６７、インスリノーマ－関連タンパク質２（ＩＡ－２）、およびインスリノーマ－関連タンパク質２β（ＩＡ－２β）、または任意の前記抗原の免疫寛容誘導部分の１つ以上を含む、請求項２０に記載の化合物。
【請求項２２】
寛容が望まれる抗原が、配列番号：１の一部を含むポリペプチドを含む、請求項２１に記載の化合物。
【請求項２３】
寛容が望まれる抗原が、配列番号：１の一部を含むアミノ酸配列ならびにＩＡ－２およびその免疫寛容誘導フラグメントの１つ以上を含むポリペプチドを含む、請求項２２に記載の化合物。
【請求項２４】
寛容が望まれる抗原が食物抗原である、請求項６－１２のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項２５】
寛容が望まれる抗原がセリアック病と関連する、請求項２４に記載の化合物。
【請求項２６】
寛容が望まれる抗原が、高分子量グルテニン、低分子量グルテニン、アルファ－グリアジン、ガンマ－グリアジン、オメガ－グリアジン、ホルデイン、セカリン、アベニン、および任意の前記抗原の免疫寛容誘導部分の１つ以上を含む、請求項２５に記載の化合物。
【請求項２７】
寛容が望まれる抗原が配列番号：２０または配列番号：２１のアミノ酸配列を含むポリペプチドを含む、請求項２５に記載の化合物。
【請求項２８】
抗原が治療薬を含み、ここで治療薬が、アブシキシマブ、アダリムマブ、アガルシダーゼアルファ、アガルシダーゼベータ、アルデスロイキン、アルグルコシダーゼアルファ、第ＶＩＩＩ因子、第ＩＸ因子、インフリキシマブ、Ｌ－アスパラギナーゼ、ラロニダーゼ、ナタリズマブ、オクトレオチド、フェニルアラニンアンモニアリアーゼ（ＰＡＬ）、またはラスブリカーゼ（ウリカーゼ）、および任意の前記抗原の免疫寛容誘導部分から選択される、請求項６－１２のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項２９】
抗原が移植抗原を含み、ここで移植抗原がＭＨＣクラスＩおよびＭＨＣクラスＩＩハプロタイプタンパク質のサブユニットならびに少数血液型抗原抗原ＲｈＣＥ、Ｋｅｌｌ、Ｋｉｄｄ、ＤｕｆｆｙおよびＳｓからなる群から選択される、請求項６－１２のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項３０】
抗原が尋常性天疱瘡、グレーブス病、視神経脊髄炎に関連する抗原、またはその免疫寛容誘導部分を含む、請求項６－１２のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項３１】
抗原が、デスモグレイン－３、デスモグレイン－１、およびデスモグレイン－４、また

はその免疫寛容誘導部分からなる群から選択される、請求項３０に記載の化合物。
【請求項３２】
第一のメタクリル酸ユニットがＷ^{1}により示され：
【化１】



ここで：
Ｒ^{9}は直接結合、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－、または－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－（ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－）$_{t}$－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－である、請求項６－３１のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項３３】
第二のメタクリル酸ユニットがＷ^{2}により示され：
【化２】



ここで：
Ｒ^{10}が脂肪族基、アルコールまたは脂肪族アルコールである、請求項６－３２のいずれかに記載の化合物。
【請求項３４】
Ｒ^{9}が－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－である；および
Ｒ^{10}が２－ヒドロキシプロピルである、請求項３３に記載の化合物。
【請求項３５】
請求項１－３４のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物。
【請求項３６】
望ましくない免疫応答の治療のための医薬の製造における使用のための、請求項１－３４のいずれか一項に記載の化合物または請求項３５に記載の組成物。
【請求項３７】
望ましくない免疫応答を治療することにおける使用のための、請求項１－３４のいずれか一項に記載の化合物または請求項３５に記載の組成物。
【請求項３８】
抗原に対する望ましくない免疫応答の治療における使用のための組成物であって、前記組成物が：
抗原；
ポリマー化リンカー；
ここで、ポリマー化リンカーが抗原にジスルフィド結合またはジスルファニルエチルエステルを介して結合され、
ここで、ジスルフィド結合またはジスルファニルエチルエステルは対象への前記化合物の

投与の際に切断され、ポリマー化リンカーから前記抗原を開放するようにそれぞれ構成されている；および
ガラクトシル化部分、を含む組成物。
【請求項３９】
抗原に対する望ましくない免疫応答の治療における使用のための組成物であって、前記組成物が：
抗原；
ポリマー化リンカー、
ここで、ポリマー化リンカーが抗原にジスルフィド結合またはジスルファニルエチルエステルを介して結合され、
ここで、ジスルフィド結合またはジスルファニルエチルエステルは対象への前記化合物の投与の際に切断され、ポリマー化リンカーから前記抗原を開放するようにそれぞれ構成されている；および
グルコシル化部分、を含む組成物。