

【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6部門第1区分

【発行日】平成30年11月22日(2018.11.22)

【公表番号】特表2018-524577(P2018-524577A)

【公表日】平成30年8月30日(2018.8.30)

【年通号数】公開・登録公報2018-033

【出願番号】特願2017-565173(P2017-565173)

【国際特許分類】

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

G 0 1 N 33/53 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/16 (2006.01)

C 0 7 K 14/705 (2006.01)

C 0 7 K 14/525 (2006.01)

【 F I 】

G 0 1 N 33/15 Z N A Z

G 0 1 N 33/53 D

C 0 7 D 471/04 1 0 8 Q

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/08

A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 K 38/16
C 0 7 K 14/705
C 0 7 K 14/525

【手続補正書】

【提出日】平成30年10月10日(2018.10.10)

【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】

腫瘍壊死因子(TNF)スーパーファミリーメンバーであるトリマータンパク質に結合し、必要なTNFスーパーファミリー受容体を介するトリマータンパク質のシグナル伝達を調節することができる化合物を同定する方法であって、トリマー-化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数を決定するステップ、それによって、化合物が受容体を介するシグナル伝達を調節することができるかどうかを同定するステップを含む、上記方法。

【請求項2】

対照と比較して、トリマー-化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数を決定するステップを含む、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

対照が、化合物の非存在下でTNFスーパーファミリーメンバーのトリマー及び必要な受容体を含み、任意に、対照と比較したトリマー-化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数の減少が、化合物が受容体を介するシグナル伝達を調節することができることを同定する、請求項2に記載の方法。

【請求項4】

対照が、TNFスーパーファミリーメンバーのトリマー、必要な受容体、及び受容体を介するトリマーのシグナル伝達を調節することが公知の化合物を含み、任意に対照と比較したトリマー-化合物複合体あたりに結合した受容体の同等の平均数、又は対照と比較したトリマー-化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数の減少が、化合物が受容体を介するシグナル伝達を調節することができることを同定する、請求項2に記載の方法。

【請求項5】

トリマー-化合物複合体あたりに結合した受容体の平均数が、3:1~10:1(受容体:トリマー)のモル比で決定される、請求項1から4のいずれかに記載の方法。

【請求項6】

化合物が、トリマー-化合物複合体あたりに平均3個未満の受容体が結合すると決定される場合、受容体を介するトリマータンパク質のシグナル伝達を調節できると同定される、請求項1から5のいずれかに記載の方法。

【請求項7】

化合物が、トリマー-化合物複合体あたりに平均2個の受容体が結合すると決定される場合、受容体を介するトリマータンパク質のシグナル伝達を調節できると同定される、請求項6に記載の方法。

【請求項8】

化合物が、トリマー-化合物複合体あたりに平均1個の受容体が結合すると決定される場合、受容体を介するトリマータンパク質のシグナル伝達を調節できると同定される、請求項6に記載の方法。

【請求項 9】

トリマー - 化合物複合体あたりに結合した受容体の数が、

- (a) イオン移動度質量分析；及び/又は
- (b) サイズ排除クロマトグラフィー；及び/又は
- (c) 凝集アッセイ；及び/又は
- (d) Forster 共鳴エネルギー移動；及び/又は
- (e) 結晶解析

によって決定される、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の方法。

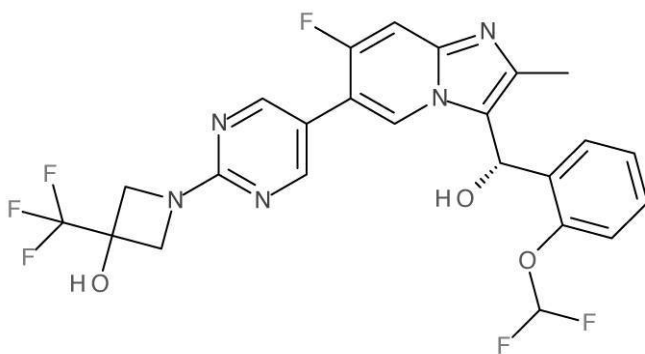
【請求項 10】

TNFスーパーファミリーメンバーがTNF であり、受容体がTNF-Rである、請求項 1 から 9 のいずれかに記載の方法。

【請求項 11】

式(5)の化合物、又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【化1】



(5)

【請求項 12】

TNFスーパーファミリーメンバーであるトリマータンパク質と、請求項 11 に記載の化合物とを含む複合体。

【請求項 13】

ヒト又は動物の身体の治療のための、請求項 11 に記載の化合物又は請求項 12 に記載の複合体を含む剤。

【請求項 14】

化合物が受容体を介してトリマーによって誘導されるシグナル伝達に拮抗する、自己免疫障害及び炎症障害；神経障害及び神経変性障害；疼痛障害及び侵害障害；並びに心血管障害の処置及び/又は防止における使用のための、任意に関節リウマチ、クローン病、乾癬、全身性エリテマトーデス、アルツハイマー病、パーキンソン病及びてんかんの処置及び/又は防止における使用のための、請求項 13 に記載の剤。

【請求項 15】

請求項 11 に記載の化合物、又は請求項 12 に記載の複合体と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。

专利名称(译)	作用机构		
公开(公告)号	JP2018524577A5	公开(公告)日	2018-11-22
申请号	JP2017565173	申请日	2015-10-22
[标]申请(专利权)人(译)	UCB制药生物藻厄尔萨尔瓦多		
申请(专利权)人(译)	UCB制药生物藻厄尔萨尔瓦多		
当前申请(专利权)人(译)	UCB制药生物藻厄尔萨尔瓦多		
[标]发明人	オCONNELLジェームスフィリップ ポータージョンロバート ローソンアレステア クロップリンボリス ラベッキステイブンエドワード ノーマンティモシージョン マクミランデイヴィッドジェームス ワレロウグラハムジョン ブルッキングスダニエルクリストファー アレクサンダーリッキピーター		
发明人	オCONNELL、ジェームス フィリップ ポーター、ジョン ロバート ローソン、アレステア クロップリン、ボリス ラベッキ、ステイブン エドワード ノーマン、ティモシー ジョン マクミラン、デイヴィッド ジェームス ワレロウ、グラハム ジョン ブルッキングス、ダニエル、クリストファー アレクサンダー、リッキ ピーター		
IPC分类号	G01N33/15 G01N33/53 C07D471/04 A61K31/506 A61P37/06 A61P29/00 A61P25/00 A61P25/04 A61P9/00 A61P19/02 A61P1/04 A61P17/06 A61P37/02 A61P25/28 A61P25/16 A61P25/08 A61K31 /496 A61K31/4439 A61P43/00 A61K38/16 C07K14/705 C07K14/525		
CPC分类号	C07D401/14 C07D471/00 C07D471/04 C07K14/525 C07K14/70575 C07K16/241 G01N33/6845 G01N2500/02 A61P35/00 A61P37/00 C07D213/72 C07D235/04 C07D239/26 C07K2317/24 C07K2317 /92 G01N2333/525 A61K47/6425 C07K2317/55 G01N33/6854 G01N33/6863		
FI分类号	G01N33/15.ZNA.Z G01N33/53.D C07D471/04.108.Q C07D471/04.CSP A61K31/506 A61P37/06 A61P29/00 A61P25/00 A61P25/04 A61P9/00 A61P29/00.101 A61P19/02 A61P1/04 A61P17/06 A61P37 /02 A61P25/28 A61P25/16 A61P25/08 A61K31/496 A61K31/4439 A61P43/00.121 A61K38/16 C07K14 /705 C07K14/525		
F-TERM分类号	4C065/AA03 4C065/BB06 4C065/CC01 4C065/DD02 4C065/EE02 4C065/HH06 4C065/JJ02 4C065 /KK04 4C065/LL01 4C065/PP03 4C065/PP08 4C065/PP14 4C065/QQ04 4C084/AA01 4C084/AA02 4C084/AA03 4C084/BA08 4C084/BA22 4C084/BA23 4C084/BA32 4C084/MA02 4C084/NA05 4C084 /NA14 4C084/ZA011 4C084/ZA021 4C084/ZA061 4C084/ZA081 4C084/ZA161 4C084/ZA361 4C084 /ZA891 4C084/ZA961 4C084/ZB071 4C084/ZB081 4C084/ZB111 4C084/ZB151 4C084/ZC751 4C086 /AA01 4C086/AA02 4C086/AA03 4C086/BC39 4C086/BC50 4C086/CB05 4C086/GA07 4C086/GA08 4C086/GA12 4C086/MA01 4C086/MA04 4C086/MA55 4C086/MA66 4C086/NA14 4C086/ZA01 4C086		

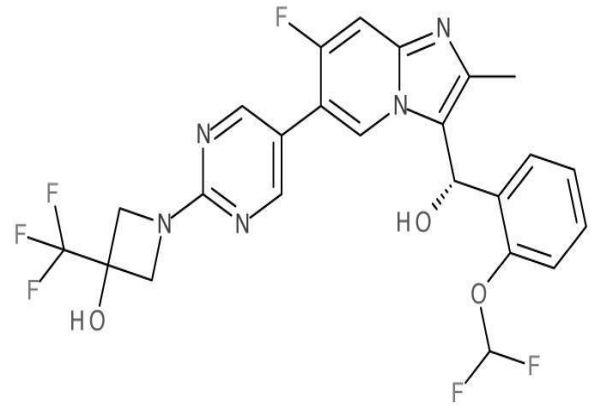
/ZA02 4C086/ZA06 4C086/ZA08 4C086/ZA16 4C086/ZA36 4C086/ZA89 4C086/ZA96 4C086/ZB07
4C086/ZB08 4C086/ZB11 4C086/ZB15 4C086/ZC75 4H045/AA10 4H045/AA30 4H045/BA50 4H045
/CA40 4H045/DA14 4H045/DA51 4H045/EA50 4H045/FA74

优先权 2015010758 2015-06-18 GB

其他公开文献 JP2018524577A
JP6659030B2

摘要(译)

本发明属于TNF信号传导领域。已经鉴定出能够调节通过受体的TNF三聚体信号传导的化合物。因此，提供了鉴定此类化合物的方法。该化合物本身可用于治疗。



(5)