

特許情報は同時に開発動向を示唆する重要なテクノロジー情報でもあります

ガイドブックシリーズのねらい

このガイドブックシリーズでは技術テーマを絞り、特許情報から見た最新のテクノロジー情報をお届けすることをねらいとしています。

編集方針は、絞り込まれた特定の技術テーマに対して下記を意図しております。

- ・最近の出願にあらわれる技術を知る
- ・最近の出願から技術課題を知る
- ・最近の出願企業を知る
- ・自己の課題の相対的位置を知る
- ・発明の出願形態(書き方、内容)を知る

★特許情報は技術者・研究者に役立つテクノロジー情報です

最近の研究開発の成果が反映されたテクノロジー情報です。競合各社の技術者・研究者も、開発に携わる皆様と同じ技術テーマについて、直面する課題や対応技術に取り組んでいます。特許情報は、それぞれが得意とする技術や注力度合い、目指す技術的方向を反映する信頼度の高い技術情報です。

★ガイドブックシリーズでは

特定テーマについて実際の製品開発や改良研究を行っている企業第一線の技術者や研究者を読者として想定しています。直近数年の特許出願に限り、技術テーマを具体的に絞り込んだうえで、特許・技術の双方をみわたすガイドとなる典型例を各巻ごとに70~200件程度、掲載しました。

各巻では、技術的観点（アングル）に従って平明でわかりやすく分類しています。それぞれのアングルには、できるだけ多くの特許情報を盛り込めるように工夫しています。また、巻頭にはガイドマップを載せています。アングルごとに内容を表わす図面を選び、扇形に配置した全体を見渡す俯瞰マップです。目次も兼ねています。さらに詳しく調べる上で役に立つ特許分類（IPC/FI）のガイドもぜひご利用ください。巻末には、収録した特許情報の一覧表を収録しました。

技術と特許の双方をにらんだ実戦的ガイドブックとして、本書をご活用ください。

株式会社ネオテクノロジー

がん遺伝子産物の全体俯瞰

本書で取り上げる技術対象

本書はがん遺伝子産物に関する分子標的薬に着目し、p53、RAS1, ErbB, PSA、新規抗原、高分子阻害剤や核酸系阻害剤、そして、阻害化合物の6つに区分けして研究者が見ておくべき特許情報96件を厳選しました。最近、がんの化学療法剤の分野で新しい抗体薬や選択制の非常に高い分子標的薬が次々と開発されてきています。本書は、がんの分子標的薬の開発の全体動向を知る情報として、また、新しい抗癌剤開発のための具体的なテーマを考えるヒント等としてご利用いただくことができます。

なお、本書ではがんの診断方法、診断薬や治療機器に関する特許情報は取り上げませんので、別のシリーズをご利用下さい。

◆RAS ErbB PSA 他

この分野では、がん遺伝子のRAS、ErbB、BCR-ABL やPSA等に関する特許情報を取り上げました。

◆p53 関連

この分野では、がん抑制遺伝子のp53-MDM2阻害剤、p53-HDM2、HDMX阻害剤等に関する特許情報を取り上げました。

◆新規抗原

この分野では、CD79B抗体、CD138抗体、CD98抗体やC-METモノクローナル抗体等に関する特許情報を取り上げました。

◆高分子系阻害剤

この分野では、遺伝子産物に結合するポリペプチド、タンパク質、抗体複合物等に関する特許情報を取り上げました。

◆核酸系阻害剤

この分野では、ポリヌクレオチド剤、アンチセンス剤、マイクロRNA等に関する特許情報を取り上げました。

◆阻害化合物

この分野では、MTH1、WEE1、RET やMET等を阻害する化合物に関する特許情報を取り上げました。

RAS ErbB PSA他

アングルの定義

この分野では、がん遺伝子のRAS、ErbB、BCR-ABLやPSA等に関する特許情報を取り上げました。

IPC		件数	FI	件数
A61P 35/00	(20060101)	14	A61P 35/00	14
A61P 43/00	(20060101)	11	A61K 45/00	7
A61K 39/395	(20060101)	7	A61P 43/00 111	6
A61K 45/00	(20060101)	7	C12N 15/00 A	6
C12N 15/09	(20060101)	7	A61K 39/395 T	5
			A61P 43/00 105	5

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全47頁) (43)公表日 平成29年(2017)4月20日

(51) Int.Cl.	テ-マコード' (参)	F I	(21)特願2016-549041
A61K 31/713 (2006.01)	4C084	A61K 31/713	(86) (22)平成27年(2015)3月16日 (85)平成28年(2016)7月27日 (86)PCT/US2015/020776 (87)W02015/139044 (87)平成27年(2015)9月17日
A61P 35/00 (2006.01)	4C086	A61P 35/00	
A61P 1/04 (2006.01)		A61P 1/04	
A61P 43/00 (2006.01)		A61P 43/00 111	
A61K 48/00 (2006.01)		A61K 48/00	
(81)指定国	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,	【 F ターム】 4C084 AA13 NA14 ZA662 ZB262 ZC022 ZC412 4C086 AA01 AA02 EA16 MA01	優(31)62/121,721 先(32)平成27年(2015)2月27日 権(33)米国(US)
[続きあり]			
(71)出願人	ポストン バイオメディカル, インコー*	アメリカ合衆国	マサチューセッツ 0 2 1 3 9 , ケ*
(72)発明者	リー, チャン, ジェー.		

(54) 【発明の名称】 K - R a s をサイレンシングする非対称干渉 R N A 組成物およびその使用方法

(57) 【要約】

本発明は、K - R a s 遺伝子発現をサイレンシングする際に使用される新規な組成物を提供する。より詳細には、本発明は、K - R a s 発現の阻害剤としての新規な非対称干渉 R N A 分子、ならびに哺乳動物における癌または関連障害の処置における医薬組成物およびその使用を提供する。

【選択図】図5 (A)

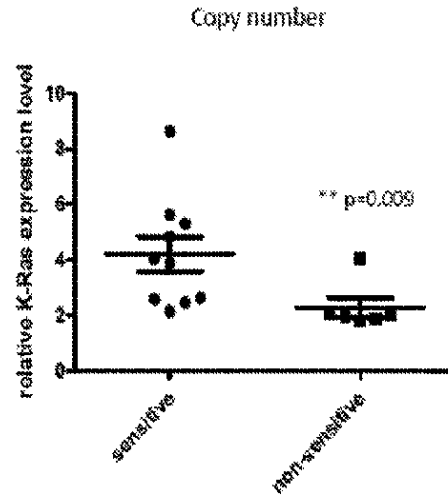


Figure 5(A)

【技術分野】

【 0 0 0 1 】

発明の分野

本発明は、一般に、K - R a s 遺伝子発現をサイレンシングする際に使用される組成物に関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

必要とする対象において癌を処置する方法であって、(i) 1 8 ~ 2 3 ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記ヌクレオチド配列が標的 K - R a s m R N A 配列と実質的に相補性がある、第一の鎖と、(i i) 1 2 ~ 1 7 ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記第一の鎖と実質的に相補性があり、前記第一

の鎖と共に二重鎖領域を形成する第二の鎖と、を含む二本鎖 R N A 分子を、必要とする対象に投与することを含み、前記第一の鎖が 1 ~ 9 ヌクレオチドの 3 ' - オーバーハングおよび 0 ~ 8 ヌクレオチドの 5 ' - オーバーハングを有し、前記二本鎖 R N A 分子が、選択的 K - R a s 遺伝子サイレンシングを実行することが可能である、方法。

【請求項 2】

選択された患者集団において癌を処置する方法であって、
(a) 癌と診断された患者候補から得られた生物学的試料中の突然変異 K - R a s 遺伝子増幅のレベルを測定するステップと；
(b) 前記患者候補の突然変異 K - R a s 遺伝子増幅レ

ベルがベンチマークレベルを超えていることを確認するステップと；

(c) (i) 18 ~ 23ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記ヌクレオチド配列が標的K - R a s mRNA配列と実質的に相補性がある、第一の鎖と、(ii) 12 ~ 17ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記第一の鎖と実質的に相補性があり、前記第一の鎖と共に二重鎖領域を形成する第二の鎖と、を含む二本鎖RNA分子を、前記患者候補に投与するステップと、
を含み、前記第一の鎖が1 ~ 9ヌクレオチドの3' - オーバーハングおよび0 ~ 8ヌクレオチドの5' - オーバーハングを有し、前記二本鎖RNA分子が、選択的K - R a s 遺伝子サイレンシングを実行することが可能である、方法。

【請求項3】

選択された患者集団において癌を処置する方法であって、

(a) 癌と診断された患者候補から得られた生物学的試料中の突然変異K - R a s タンパク質の発現レベルを測定するステップと；

(b) 前記患者候補の突然変異K - R a s タンパク質発現レベルがベンチマークレベルを超えていることを確認するステップと；

(c) (i) 18 ~ 23ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記ヌクレオチド配列が標的K - R a s mRNA配列と実質的に相補性がある、第一の鎖と、(ii) 12 ~ 17ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記第一の鎖と実質的に相補性があり、前記第一の鎖と共に二重鎖領域を形成する第二の鎖と、を含む二本鎖RNA分子を、前記患者候補に投与するステップと、
を含み、前記第一の鎖が1 ~ 9ヌクレオチドの3' - オーバーハングおよび0 ~ 8ヌクレオチドの5' - オーバーハングを有し、前記二本鎖RNA分子が、選択的K - R a s 遺伝子サイレンシングを実行することが可能である、方法。

【請求項4】

前記癌が胃癌であるか、または前記対象が胃癌に罹患している、もしくは胃癌の素因がある、前記請求項のいずれか1項に記載の方法。

【請求項5】

前記第一の鎖の前記ヌクレオチド配列が、前記標的K - R a s mRNA配列と少なくとも70%の相補性がある配列を含む、前記請求項のいずれか1項に記載の方法。

【請求項6】

前記第一の鎖が、19 ~ 23ヌクレオチドの長さを有する、前記請求項のいずれか1項に記載の方法。

【請求項7】

前記第一の鎖が、21ヌクレオチドの長さを有する、前記請求項のいずれか1項に記載の方法。

【請求項8】

前記第二の鎖が、14 ~ 16ヌクレオチドの長さを有する、請求項7に記載の方法。

【請求項9】

前記第二の鎖が、15ヌクレオチドの長さを有する、請求項8に記載の方法。

【請求項10】

前記第一の鎖が、2 ~ 4ヌクレオチドの3' - オーバーハングを有する、請求項9に記載の方法。

【請求項11】

前記第一の鎖が、3ヌクレオチドの3' - オーバーハングを有する、請求項10に記載の方法。

【請求項12】

前記二本鎖RNA分子が、少なくとも1つの修飾ヌクレオチドまたはその類似体を含む、前記請求項のいずれか1項に記載の方法。

【請求項13】

前記少なくとも1つの修飾ヌクレオチドまたはその類似体が、糖 -、バックボーン -、および/または塩基 - 修飾リボヌクレオチドである、請求項12に記載の方法。

【請求項14】

前記バックボーン修飾リボヌクレオチドが、別のリボヌクレオチドとのホスホジエステル結合内に修飾を有する、請求項13に記載の方法。

【請求項15】

前記第一の鎖が、SEQ ID NO: 638 ~ 955からなる群から選択されるアンチセンス鎖配列を含む、前記請求項のいずれか1項に記載の方法。

【請求項16】

前記第二の鎖が、SEQ ID NO: 320 ~ 637からなる群から選択されるセンス鎖配列を含む、請求項1 ~ 14のいずれか1項に記載の方法。

【請求項17】

前記第一の鎖が、SEQ ID NO: 638 ~ 955からなる群から選択されるアンチセンス鎖配列を含み、前記第二の鎖が、SEQ ID NO: 320 ~ 637からなる群から選択されるセンス鎖配列を含む、請求項1 ~ 14のいずれか1項に記載の方法。

【請求項18】

前記対象が、ヒトである、前記請求項のいずれか1項に記載の方法。

【請求項19】

(i) 18 ~ 23ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記ヌクレオチド配列が標的K - R a s mRNA配列と実質的に相補性がある、第一の鎖と、(ii) 12 ~ 17ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記第一の鎖と実質的に相補性があり、前記第一の鎖と共に二重鎖領域を形成する第二の鎖と、を含む

二本鎖RNA分子であって、前記第一の鎖が1～9ヌクレオチドの3'-オーバーハングおよび0～8ヌクレオチドの5'-オーバーハングを有し、前記二本鎖RNA分子が、選択的K-Ras遺伝子サイレンシングを実行することが可能である、前記二本鎖RNA分子。

【請求項20】

前記第一の鎖の前記ヌクレオチド配列が、前記標的K-Ras mRNA配列と少なくとも70%の相補性がある配列を含む、請求項19に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項21】

前記第一の鎖が、19～23ヌクレオチドの長さを有する、請求項19または20に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項22】

前記第一の鎖が、21ヌクレオチドの長さを有する、請求項19～21のいずれか1項に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項23】

前記第二の鎖が、14～16ヌクレオチドの長さを有する、請求項22に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項24】

前記第二の鎖が、15ヌクレオチドの長さを有する、請求項23に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項25】

前記第一の鎖が、2～4ヌクレオチドの3'-オーバーハングを有する、請求項24に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項26】

前記第一の鎖が、3ヌクレオチドの3'-オーバーハングを有する、請求項25に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項27】

前記二本鎖RNA分子が、少なくとも1つの修飾ヌクレオチドまたはその類似体を含む、請求項19～26のいずれか1項に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項28】

前記少なくとも1つの修飾ヌクレオチドまたはその類似体が、糖-、バックボーン-、および/または塩基-修飾リボヌクレオチドである、請求項27に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項29】

前記バックボーン修飾リボヌクレオチドが、別のリボヌ

クレオチドとのホスホジエステル結合内に修飾を有する、請求項28に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項30】

前記第一の鎖が、SEQ ID NO: 638～955からなる群から選択されるアンチセンス鎖配列を含む、請求項19～29のいずれか1項に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項31】

前記第二の鎖が、SEQ ID NO: 320～637からなる群から選択されるセンス鎖配列を含む、請求項19～29のいずれか1項に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項32】

前記第一の鎖が、SEQ ID NO: 638～955からなる群から選択されるアンチセンス鎖配列を含み、前記第二の鎖が、SEQ ID NO: 320～637からなる群から選択されるセンス鎖配列を含む、請求項19～29のいずれか1項に記載の二本鎖RNA分子。

【請求項33】

必要とする対象において癌を処置する方法であって、前記対象においてK-Ras遺伝子発現またはK-Ras活性を阻害することを含む、方法。

【請求項34】

必要とする対象において癌幹細胞(CSC)の生存および/または増殖を阻害する方法であって、前記対象においてK-Ras遺伝子発現またはK-Ras活性を阻害することを含む、方法。

【請求項35】

K-Ras遺伝子発現またはK-Ras活性を阻害することが、(i)18～23ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記ヌクレオチド配列が標的K-Ras mRNA配列と実質的に相補性がある、第一の鎖と、(ii)12～17ヌクレオチドの長さのヌクレオチド配列を含み、前記第一の鎖と実質的に相補性があり、前記第一の鎖と共に二重鎖領域を形成する第二の鎖と、を含む二本鎖RNA分子を、必要とする対象に投与することを含み、前記第一の鎖が1～9ヌクレオチドの3'-オーバーハングおよび0～8ヌクレオチドの5'-オーバーハングを有し、前記二本鎖RNA分子が、選択的K-Ras遺伝子サイレンシングを実行することが可能である、請求項34に記載の方法。

p53関連

アングルの定義

この分野では、がん抑制遺伝子のp53-MDM2阻害剤、p53-HDM2、HDMX阻害剤等に関する特許情報を取り上げました。

IPC	件数	FI	件数
A61P 35/00 (20060101)	7	A61P 35/00	7
A61P 43/00 (20060101)	6	A61K 45/00	4
A61K 45/00 (20060101)	4	A61K 37/02	3
A61K 38/00 (20060101)	3	A61P 43/00 105	3
A61K 31/496 (20060101)	2	A61P 43/00 121	3
以下続く			

(51) Int.Cl.	テ-マコード' (参)	F I	(21)特願2016-150429
C07K 11/02 (2006.01)		C07K 11/02 ZNA	(62)特願2013-524901の分割
A61K 38/00 (2006.01)		A61K 37/02	原願 平成23年(2011)8月13日
A61P 35/00 (2006.01)		A61P 35/00	(22)平成28年(2016)7月29日
			優(31)61/373,638
			先(32)平成22年(2010)8月13日
			権(33)米国(US)
			優(31)61/373,701
			先(32)平成22年(2010)8月13日
			権(33)米国(US)

[続きあり]

(71)出願人 エイルロン セラピューティクス, インコ* アメリカ合衆国マサチューセッツ州02139, ケンブ*
(72)発明者 ゲラヴァイス, ヴァンサン (外1名)

(54)【発明の名称】ペプチド模倣大環状分子

(57)【要約】 (修正有)

【課題】 p 5 3 及び HDM 2、p 5 3 及び HDM X、又は p 5 3 及び HDM 2 と HDM X 両方のタンパク質との間の相互作用を阻害することで p 5 3 の活性を調節し、かつ、癌及び他の過剰増殖性疾患（ただし、これらには限定されない）を含む疾患の治療に使用することが可能な、p 5 3 を利用したペプチド模倣大環状分子の提供。

【解決手段】 安定に架橋されているヒトの p 5 3 の一部からなるペプチドであり、架橋ペプチドは修飾されたアミノ酸を少なくとも 2 つ含み、p 5 3 の HDM 2 への結合及び p 5 3 の HDM X への結合に重要だと考えられている p 5 3 の一部の -ヘリックス二次構造を安定化できる分子内架橋を形成した、p 5 3 ペプチド模倣大環状分子。

【選択図】 なし

【発明を実施するための形態】

【0021】

[0 0 2 0] 本明細書で使用する場合、「大環状分子」という用語は、少なくとも 9 個の共有結合した原子で形成されている環又は輪を含む化学構造を有する分子を指す。

[0 0 2 1] 本明細書で使用する場合、「ペプチド模倣大環状分子」又は「架橋ポリペプチド」という用語は、同じ分子の中に、複数のペプチド結合で連結された複数のアミノ酸残基と、第一の天然に存在する又は天然に存在しないアミノ酸残基（又は類似体）と第二の天然に存在する又は天然に存在しないアミノ酸残基（又は類似体）との間に大環状分子を形成する少なくとも 1 つの大環状分子形成リンカーを含む化合物を指す。ペプチド模倣大環状分子は、大環状分子形成リンカーが第一のアミノ酸残基（又は類似体）の炭素を第二のアミノ酸残基（又は類似体）の炭素に連結している態様を含む。ペプチド模倣大環状分子は、1 つ以上のアミノ酸残基及び/又はアミノ酸類似体残基との間に 1 つ以上の非ペプチド結合を含んでいてもよく、かつ、大環状分子を形成する [続きあり]

【技術分野】

【0001】

関連出願

[0 0 0 1] 本出願は、2010年8月13日出願の米国仮特許出願第 61 / 373, 701 号、2010年8月13日出願の同第 61 / 373, 638 号、及び 2010年8月16日出願の同第 61 / 374, 163 号の優先権を主張し、その全体は参照によりここで本明細書に組み込まれる。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

配列番号 289, 290, 374, 375, 624, 642, 689, 699, 702, 703, 704, 及び

714 から選択されるアミノ酸配列と、少なくとも 80 % 同一であり、F、W、および L が同じ位置に含まれるアミノ酸配列を含むペプチド模倣大環状分子。

【請求項 2】

配列番号 289, 290, 374, 375, 624, 642, 689, 699, 702, 703, 704, 及び 714 から選択されるアミノ酸配列と、少なくとも 90 % 同一のアミノ酸配列を含む、請求項 1 に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項 3】

配列番号 289, 290, 374, 375, 624, 642, 689, 699, 702, 703, 704, 及び 714 から選択されるアミノ酸配列と、少なくとも 95 % 同一のアミノ酸配列を含む、請求項 1 に記載のペプチ

ド模倣大環状分子。

【請求項4】

配列番号289, 290, 374, 375, 624, 642, 689, 699, 702, 703, 704, 及び714から選択されるアミノ酸配列を含む、請求項1に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項5】

該ペプチド模倣大環状分子がヘリックスを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項6】

ヘリックスが α -ヘリックスである、請求項5に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項7】

該ペプチド模倣大環状分子が β -二置換アミノ酸を含む、請求項1～6のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項8】

該ペプチド模倣大環状分子が少なくとも2つのアミノ酸の α 位同士を連結する架橋剤を含む、請求項1～7のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項9】

前記2つのアミノ酸の少なくとも1つが β -二置換アミノ酸である、請求項8のペプチド模倣大環状分子。

【請求項10】

配列番号289, 290, 374, 375, 624, 642, 689, 699, 702, 703, 704, 及び714から選択されるアミノ酸配列と、少なくとも80%同一であるアミノ酸配列を含むペプチド模倣大環状分子であって、ヘリックスを含む前記ペプチド模倣大環状分子。

【請求項11】

配列番号289, 290, 374, 375, 624, 642, 689, 699, 702, 703, 704, 及び714から選択されるアミノ酸配列と、少なくとも90%同一のアミノ酸配列を含む、請求項10に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項12】

配列番号289, 290, 374, 375, 624, 642, 689, 699, 702, 703, 704, 及び714から選択されるアミノ酸配列と、少なくとも95%同一のアミノ酸配列を含む、請求項10に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項13】

配列番号289, 290, 374, 375, 624, 642, 689, 699, 702, 703, 704, 及び714から選択されるアミノ酸配列を含む、請求項10に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項14】

ヘリックスが α -ヘリックスである、請求項10～13

のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項15】

該ペプチド模倣大環状分子が β -二置換アミノ酸を含む、請求項10～14のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項16】

該ペプチド模倣大環状分子が少なくとも2つのアミノ酸の α 位同士を連結する架橋剤を含む、請求項10～15のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

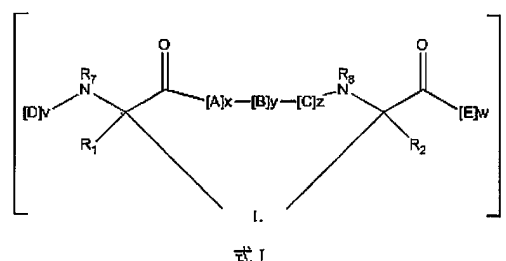
【請求項17】

前記2つのアミノ酸の少なくとも1つが β -二置換アミノ酸である、請求項16のペプチド模倣大環状分子。

【請求項18】

該ペプチド模倣大環状分子が式

【化1】



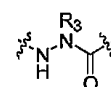
を有し、

式中、

A、C、D、及びEはそれぞれ独立して、天然又は非天然のアミノ酸であり、かつ、D及びEは独立してキャッピング基を含んでいてもよく、

Bは、天然若しくは非天然のアミノ酸、アミノ酸類似体、又は

【化2】



であり、

R₁及びR₂は独立して、非置換又はハロ置換されている、 α -H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリーールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアルキル、又はヘテロシクロアルキルであり、R₃は、R₅で置換されていてもよい、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリーールアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアリーール、又はヘテロシクロアリーールであり、

Lは式 - L₁ - L₂ - の大環状分子形成リンカーであり、

L₁及びL₂は独立してアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、ヘテロアルキレン、シクロアルキレン、ヘテロシクロアルキレン、シクロアリーレン、ヘテロシク

ロアリーレン、又は $[-R_4 - K - R_4 -]_n$ であり、それぞれは R_5 で置換されていてもよく；

R_4 はそれぞれアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、ヘテロアルキレン、シクロアルキレン、ヘテロシクロアルキレン、アリーレン、又はヘテロアリーレンであり；

K はそれぞれ、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 、 CO 、 CO_2 、又は $CONR_3$ であり；

R_5 はそれぞれ独立して、ハロゲン、アルキル、 $-OR_6$ 、 $-N(R_6)_2$ 、 $-SR_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、蛍光性部分、放射性同位元素又は治療薬であり；

R_6 はそれぞれ独立して、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、蛍光性部分、放射性同位元素又は治療薬であり；

R_7 は、 R_5 で置換されていてもよい、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアリール若しくはヘテロシクロアリール、又はD残基を有する環状構造の一部であり；

R_8 は、 R_5 で置換されていてもよい、 $-H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアリール若しくはヘテロシクロアリール、又はE残基を有する環状構造の一部であり；

v 及び w は独立して $1 \sim 1000$ の整数であり；

u は $1 \sim 10$ の整数であり；

x 、 y 及び z は独立して $0 \sim 10$ の整数であり；並びに n は $1 \sim 5$ の整数である、請求項 1 ~ 17 のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項19】

L がチオエーテル又はトリアゾールを含まない、請求項18に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項20】

該ペプチド模倣大環状分子が、該ペプチド模倣大環状分子内の第一のアミノ酸の主鎖のアミノ基と第二のアミノ酸を連結する架橋剤を含む、請求項1または10に記載ペプチド模倣大環状分子。

【請求項21】

R^1 および R^2 がHである、請求項18に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項22】

R^1 および R^2 が独立にアルキルである、請求項18に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項23】

R^1 および R^2 がメチルである、請求項18に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項24】

対象の癌の治療に使用される、請求項1～23のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項25】

対象中のp53、HDM2、HDMX、又はその組み合わせの活性の調節に使用される、請求項1～23のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項26】

対象中のp53とHDM2、又はp53とHDMXタンパク質間の相互作用を拮抗するために使用される、請求項1～23のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子。

【請求項27】

請求項1～23のいずれか1項に記載のペプチド模倣大環状分子を含有する医薬組成物。

(補正済み)

IPC/FIガイド

IPC/FIガイド

深掘した調査を行う上でのガイドとしてもご利用いただけます。深掘調査には特許分類 IPC（国際特許分類）や日本特許庁独自の FI（ファイルインデックス）を使うと便利です。この IPC/FI ガイドでは、本書で実際にとりあげた全アングルの特許情報に用いられている IPC と FI を抽出し、掲載しています。実際の公報に付与されている IPC と FI を知り、それに基づいて類似の公報を探る場合の手がかりとしてご利用いただくことを目的としています。IPC、FI の説明は「特許情報プラットフォーム」をご参照ください。

「特許情報プラットフォーム」<https://www.j-platpat.inpit.go.jp/>

がん遺伝子産物の全体俯瞰 上位 5 位の IPC/FI

- ・ 頻出度上位 5 位までを掲載しています。
- ・ IPC は発明情報、付加情報の区別なく集計しています。
- ・ FI は公報フロントページではなく、審査経過情報に付与されている FI を記載しています。編集時点で審査経過情報の無いものは除いています。

RAS ErbB PSA 他: 14 件

IPC	件数	FI	件数
A61P 35/00 (20060101)	14	A61P 35/00	14
A61P 43/00 (20060101)	11	A61K 45/00	7
A61K 39/395 (20060101)	7	A61P 43/00 111	6
A61K 45/00 (20060101)	7	C12N 15/00 A	6
C12N 15/09 (20060101)	7	A61K 39/395 T	5
		A61P 43/00 105	5

p53 関連: 7 件

IPC	件数	FI	件数
A61P 35/00 (20060101)	7	A61P 35/00	7
A61P 43/00 (20060101)	6	A61K 45/00	4
A61K 45/00 (20060101)	4	A61K 37/02	3
A61K 38/00 (20060101)	3	A61P 43/00 105	3
A61K 31/496 (20060101)	2	A61P 43/00 121	3
以下続く			