

2004年度知的財産翻訳検定問題【化学】

解答作成前に必ず下記の注意事項に目を通してください。

【解答にあたっての注意事項】

1. 問題は2題あります。
2. 解答はすべて米国出願を前提とした英文に翻訳してください。ただし、順序は変えないでください。
3. 用語の選定に当たっては、解答部分以外の部分を参照しなくとも意味が通じるように注意を払ってください。
4. 正確・簡潔・かつ明快な英語で表現してください。
5. 解答には、問題についている【請求項*】やパラグラフ番号を英訳に添えてください。
6. 問2の式(I)は、本文上部にある「課題図表を見る>」から閲覧してください。

問1. 次の明細書(抜粋)を英文に翻訳してください。

(注: 式中のmとnは下つき文字として扱ってください)

【請求項1】

式(I)



(式中、Sは被検化合物残基を表し、LはSとBとをLを介して位置特異的かつ化学的に結合させることができる生体適合性高分子残基を表し、Fは画像化試薬残基を表し、Bは1~60個のLと1~10個のFとをBを介して化学的に結合させることができる、または1~60個のLと結合することのできるリンカーを表し、mは1~60の整数を表し、nは0~10の整数を表す)で表されることを特徴とする被検化合物の生体内集積部位検出用プローブ。

【請求項2】

Lが、N-(2-ヒドロキシプロピル)メタクリルアミド残基である請求項1記載のプローブ。

【請求項3】

Gal 1-4GlcNAc 1-3Gal 1-4Glcで表されるオリゴ糖(LNnT)または構造中にLNnTモチーフを有するオリゴ糖誘導体の残基と生理活性物質残基とを含む化合物であって、動物に投与した場合、脾臓、胸腺、精巣および前立腺からなる群より選ばれる一つ以上の臓器に特異的に集積し、該生理活性物質を該臓器に送達する

ことができる輸送性化合物。

【0011】

医薬品の治療効果は、薬物の生体内作用部位への到達量、薬物の体内動態、薬物に対する生体感受性に影響されて変化する。また非作用部位での薬効発現は、副作用につながる。部位特異的な薬物送達（以下、ターゲティングという）は、標的部位での薬物濃度を上昇させることによってその薬効を増強するだけでなく、このような副作用を低下させる。

【0012】

薬物ターゲティングの方法としては、プロドラッグ化の方法と薬物輸送体（キャリアー）を用いる方法が知られている。前者は作用部位環境で薬物が活性体となるように化学修飾を施すもので、後者は薬物を作用部位へ特異的に送達することが可能な素子を、薬物と結合させるものである。さらに、キャリアーを用いる方法には能動的ターゲティングと受動的ターゲティングがある。能動的ターゲティングは、作用部位に親和性を示すリガンドをキャリアーに付加するものであり、受動的ターゲティングは、非作用部位への集積を回避するような物理化学的性質をキャリアーにもたせるものである。一般的に能動的ターゲティングを用いた場合の方が受動的ターゲティングを用いた場合より体内分布の選択性が高く、低投与量で高い薬効が得られる。

【0021】

また、化合物（a）を前記同様の塩基存在下、無水コハク酸、無水グルタル酸等の酸無水物と反応させることによって化合物（b）を製造することができる。化合物（b）は、陰イオン交換クロマトグラフィー、疎水クロマトグラフィー、逆相クロマトグラフィー、二相分配、再結晶等の既知の方法で、任意の純度で精製、単離することができる。

【0031】

化合物（b）を、メタノール、エタノール等のアルコールを大過剰モル当量含む塩化メチレン、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、トルエン、テトラヒドロフラン、アセトニトリル等の適当な溶媒に溶解または懸濁し、1～30モル当量のトリメチルシリルジアゾメタンと-20～150 で1時間～10日間反応させることによっても、化合物（c）が得られる。

【0041】

（工程4）

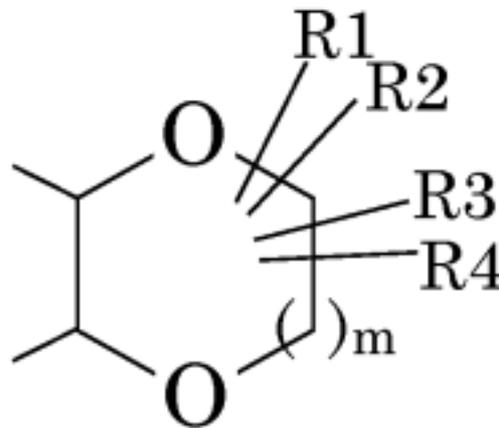
オリゴ糖A（LNnT）とオリゴ糖B（6'-SLNnT）およびオリゴ糖D（O-アセチル-LNnT）をWO99/40205に記載の方法に準じて合成した。また、オリゴ糖C（ラクトース：Gal 1-4Glc）としては市販品（国産化学社製）を使った。カバクンガン（Cabacungan）らの方法[アナリティカル・バイオケミストリー（Analytical Biochemistry）124巻、272-278ページ（1982）]に従ってオリゴ糖A、B、CおよびDをそれぞれ化合物3に導入して化合物4A、4B、4Cおよび4Dを得た。化合物4A、4B、4Cおよび4Dの精製は、反応液を水で平衡化したSephadex G-25（Ame

rshamPharmacia Biotech社製)に通塔して行った。

問2．次のクレームの指定部分(***START***から***END***まで)を英文に翻訳してください。

一般式(I)

式(I)(リンク先参照)



式中, mは0 ~ 4の整数を表し,

(i) R1, R2, R3およびR4は同一または異なって, 水素原子, 置換もしくは非置換の低級アルキル, 置換もしくは非置換のシクロアルキル, ポリシクロアルキル, 置換もしくは非置換の低級アルコシカルボニル, 置換もしくは非置換の低級アルカノイル, 置換もしくは非置換の低級アルカノイルオキシ, シアノ, ヒドロキシ, 置換もしくは非置換の低級アルコキシ, 置換もしくは非置換のシクロアルコキシ, 置換もしくは非置換の低級アルケニル, 置換もしくは非置換のシクロアルケニル, 置換もしくは非置換のアリール, 置換もしくは非置換の芳香族複素環基, 置換もしくは非置換のアラルキルを表すか,

START

(ii) R1, R2, R3およびR4の中で同一炭素原子上に存在する2つの基がその炭素原子と一緒にあって飽和炭素環を形成するか,

(iii) R1, R2, R3およびR4の中で隣接する炭素原子上に存在する2つの基がそれぞれが隣接する2つの炭素原子と一緒にあって飽和炭素環を形成するか,

(iv) R1, R2, R3およびR4の中で隣接する炭素原子上に存在する2つの基と一緒にあって結合を表し(すでに存在する結合と一緒にあって二重結合を形成する),

END

で表される化合物。