

【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22年2月4日(2010.2.4)

【公表番号】特表2008-542399(P2008-542399A)

【公表日】平成20年11月27日(2008.11.27)

【年通号数】公開・登録公報2008-047

【出願番号】特願2008-514966(P2008-514966)

【国際特許分類】

A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/48	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/08	(2006.01)
C 0 7 K	14/505	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	37/02
A 6 1 K	47/48
A 6 1 P	13/12
A 6 1 P	7/06
A 6 1 P	7/08
C 0 7 K	14/505 Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成21年12月8日(2009.12.8)

【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】

エリスロポエチンレセプター(EPO-R)に結合して活性化する化合物を含み、患者の体重1kg当たり前記化合物0.025~0.5mgの治療上有効量で投与される、エリスロポエチンの欠乏または少ないもしくは欠陥のある赤血球集団によって特徴づけられる障害を有する患者を治療するための医薬組成物であって、ここで、前記化合物は、

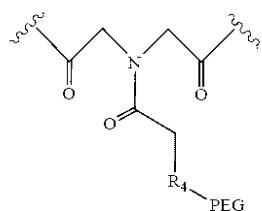
(a) 第1ペプチドモノマーおよび第2ペプチドモノマーを含み、ここで、前記第1および第2ペプチドモノマーはアミノ酸配列(AcG)GLYACHMGPIT(1-naI)VCQPLRを含む、ペプチドダイマー部分と；

(b) 前記ペプチドモノマーを共有結合するリンカー部分と；

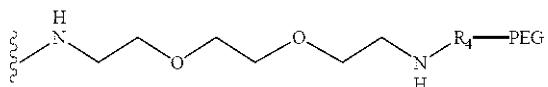
(c) 10,000~60,000ダルトンの分子量を有する直鎖状で分岐していないポリ(エチレングリコール)(PEG)を含む少なくとも1つのPEG部分と；

(d) 前記少なくとも1つのPEG部分を前記リンカー部分に共有結合させ、以下からなる群から選択される1つの式を有するスペーサー部分であって、

## 【化1】

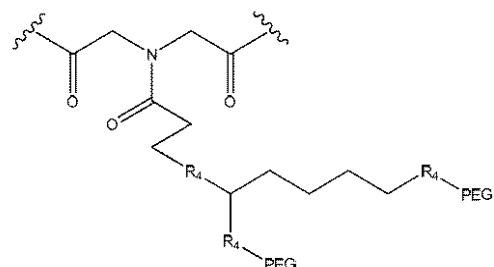


## 【化2】



及び

## 【化3】



ここで、各R4は、独立してNH、NHCO、CO、COOおよびNHC0Oから成る群から選択されるものを含む、前記医薬組成物。

## 【請求項2】

前記アミノ酸配列が、(MeG)、Kまたは(MeG)Kを更に含む、請求項1に記載の医薬組成物。

## 【請求項3】

前記アミノ酸配列が(AcG)GLYACHMGPIT(1-na1)VCQPLRKである、請求項2に記載の医薬組成物。

## 【請求項4】

前記アミノ酸配列が(AcG)GLYACHMGPIT(1-na1)VCQPLR(MeG)である、請求項2に記載の医薬組成物。

## 【請求項5】

前記アミノ酸配列が(AcG)GLYACHMGPIT(1-na1)VCQPLR(MeG)Kである、請求項2に記載の医薬組成物。

## 【請求項6】

前記スペーサーがイミノ二酢酸リンカーである、請求項1に記載の医薬組成物。

## 【請求項7】

前記スペーサーが原子10個-PEG(2,2'-(エチレンジオキシ(ビス(エチルアミン)))である、請求項1に記載の医薬組成物。

## 【請求項8】

前記リンカーリジンである、請求項1に記載の医薬組成物。

## 【請求項9】

前記PEGが10,000～60,000ダルトンである、請求項1に記載の医薬組成物。

## 【請求項10】

前記PEGが20,000～40,000ダルトンである、請求項9に記載の医薬組成物。

**【請求項11】**

前記医薬組成物が、薬学的に許容可能なキャリアを更に含む、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項12】**

前記障害が腎不全または透析である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項13】**

前記治療上有効量が、患者の体重1kg当たり前記化合物0.025～0.2mgの用量である、請求項12に記載の医薬組成物。

**【請求項14】**

前記用量が、患者の体重1kg当たり前記化合物0.05～0.1mgである、請求項13に記載の医薬組成物。

**【請求項15】**

前記障害が悪性腫瘍と関連した貧血症である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項16】**

前記治療上有効量が、患者の体重1kg当たり前記化合物0.075～0.5mgの用量である、請求項15に記載の医薬組成物。

**【請求項17】**

前記用量が、患者の体重1kg当たり前記化合物0.2～0.4mgである、請求項16に記載の医薬組成物。

**【請求項18】**

前記治療上有効量が3～4週間に1回投与される、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項19】**

前記障害が、赤芽球癆(PRCA)である、請求項1に記載の医薬組成物。

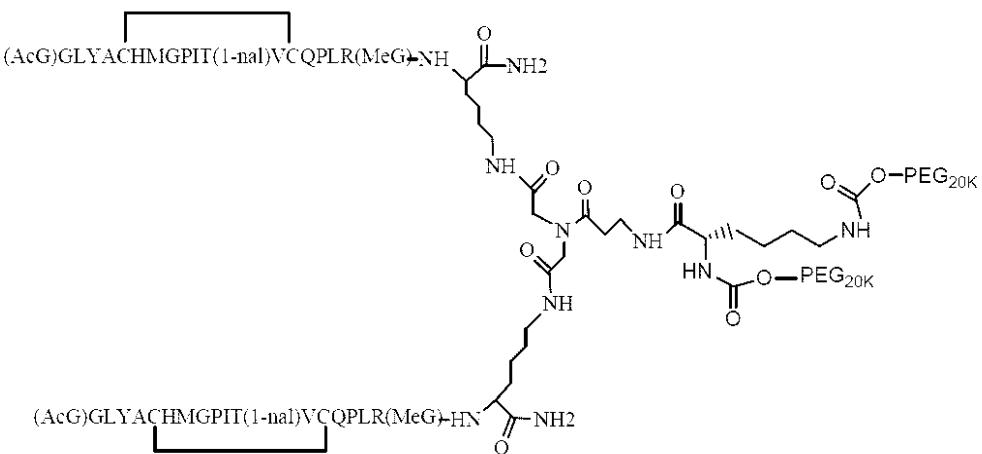
**【請求項20】**

前記リンカーが第3級アミドリンカーである、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項21】**

前記化合物が以下：

**【化4】**



である、請求項1、2、5、6、8～20のうちのいずれか1項に記載の医薬組成物。