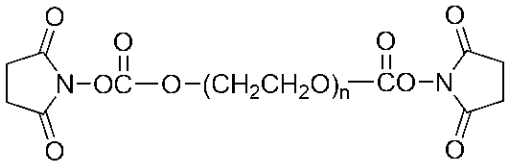
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年8月29日(2022.8.29)

【公開番号】特開2022-120193(P2022-120193A)
【公開日】令和4年8月17日(2022.8.17)
【年通号数】公開公報(特許)2022-150
【出願番号】特願2022-98871(P2022-98871)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｋ　7/64(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　1/113(2006.01)
Ａ６１Ｋ38/12(2006.01)
Ａ６１Ｋ47/60(2017.01)
Ａ６１Ｐ43/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ27/06(2006.01)
Ａ６１Ｐ27/02(2006.01)
Ａ６１Ｐ29/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ19/02(2006.01)
Ａ６１Ｐ11/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ11/06(2006.01)
Ａ６１Ｐ　9/10(2006.01)
Ａ６１Ｐ17/02(2006.01)
Ａ６１Ｐ37/06(2006.01)
Ａ６１Ｐ　7/06(2006.01)
Ａ６１Ｐ13/12(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｋ　7/64　　ＺＮＡ
Ｃ０７Ｋ　1/113
Ａ６１Ｋ38/12
Ａ６１Ｋ47/60
Ａ６１Ｐ43/00　１１１
Ａ６１Ｐ27/06
Ａ６１Ｐ27/02
Ａ６１Ｐ29/00　１０１
Ａ６１Ｐ19/02
Ａ６１Ｐ11/00
Ａ６１Ｐ11/06
Ａ６１Ｐ　9/10
Ａ６１Ｐ17/02
Ａ６１Ｐ37/06
Ａ６１Ｐ　7/06
Ａ６１Ｐ13/12

【手続補正書】
【提出日】令和4年8月19日(2022.8.19)
【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】
４０kDの分子量を有し、２個のコンプスタチン類似体の各々に結合した直鎖状ＰＥＧ部分を含む長時間作用型コンプスタチン類似体であって、
ｉ)各コンプスタチン類似体がＣＡ２８－ＡＥＥＡｃ－Ｌｙｓ部分であり；
ii)直鎖状ＰＥＧがアミド結合を介してＣＡ２８－ＡＥＥＡｃ－Ｌｙｓのリシン側鎖に結合し；
iii)各ＣＡ２８－ＡＥＥＡｃ－Ｌｙｓ部分がＡｃ－Ｉｌｅ－Ｃｙｓ＊－Ｖａｌ－(１Ｍｅ)Ｔｒｐ－Ｇｌｎ－Ａｓｐ－Ｔｒｐ－Ｇｌｙ－Ａｌａ－Ｈｉｓ－Ａｒｇ－Ｃｙｓ＊－Ｔｈｒ－［ＮＨ－ＣＨ２ＣＨ２ＯＣＨ２ＣＨ２ＯＣＨ２－Ｃ(＝Ｏ)］－Ｌｙｓ－ＮＨ２(配列番号５１)であり、ここでＣｙｓ＊がジスルフィド結合で結合しているものである、長時間作用型コンプスタチン類似体。
【請求項２】
２個のＣＡ２８－ＡＥＥＡｃ－Ｌｙｓ部分を４０kDの分子量を有する二官能性直鎖状ＰＥＧ部分と結合させることにより得られるコンプスタチン類似体であって、
ｉ)二官能性直鎖状ＰＥＧ部分がアミド結合を介してＣＡ２８－ＡＥＥＡｃ－Ｌｙｓ部分のＬｙｓ側鎖と結合し；
ii)各ＣＡ２８－ＡＥＥＡｃ－Ｌｙｓ部分がＡｃ－Ｉｌｅ－Ｃｙｓ＊－Ｖａｌ－(１Ｍｅ)Ｔｒｐ－Ｇｌｎ－Ａｓｐ－Ｔｒｐ－Ｇｌｙ－Ａｌａ－Ｈｉｓ－Ａｒｇ－Ｃｙｓ＊－Ｔｈｒ－［ＮＨ－ＣＨ２ＣＨ２ＯＣＨ２ＣＨ２ＯＣＨ２－Ｃ(＝Ｏ)］－Ｌｙｓ－ＮＨ２(配列番号５１)であり、ここでＣｙｓ＊がジスルフィド結合で結合しているものである、長時間作用型コンプスタチン類似体。
【請求項３】
二官能性直鎖状ＰＥＧ部分が式IVa
【化１】



式IVａ

のものである、請求項２に記載の長時間作用型コンプスタチン類似体。
【請求項４】
請求項１～３のいずれか一項に記載の長時間作用型コンプスタチン類似体および薬学的に許容される担体を含む、組成物。
【請求項５】
医薬として使用するための、請求項４に記載の組成物。
【請求項６】
細胞または臓器の補体依存性傷害に対する感受性を低下させることに使用するための、請求項４に記載の組成物。
【請求項７】
補体介在性障害の処置に使用するための、請求項４に記載の組成物。
【請求項８】
加齢黄斑変性症(ＡＭＤ)の地図状萎縮(ＧＡ)の処置または予防に使用するための、請求項４に記載の組成物。
【請求項９】
対象の眼に投与されるものである、請求項８に記載の組成物。
【請求項１０】
硝子体内投与されるものである、請求項９に記載の組成物。
【請求項１１】

移植拒絶反応、虚血／再灌流傷害、溶血性貧血、自己免疫疾患、神経障害性疼痛、膜性増殖性糸球体腎炎、視神経脊髄炎、脊髄損傷、喘息、発作性夜間血色素尿症(ＰＮＨ)または慢性閉塞性肺疾患(ＣＯＰＤ)の処置に使用するための、請求項４に記載の組成物。

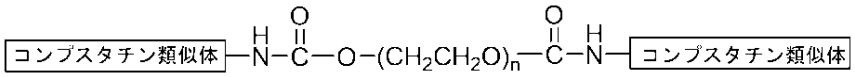
【請求項１２】

皮下投与または静脈内投与により投与されるものである、請求項５～７および１１のいずれか一項に記載の使用のための組成物。

【請求項１３】

次の構造：

【化２】



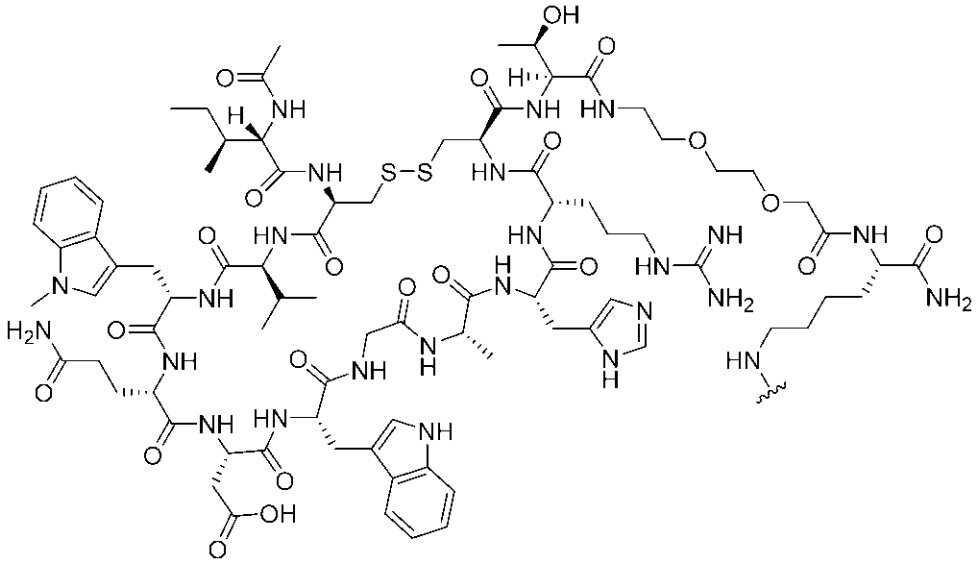
〔式中、

【化３】



は

【化４】



であり、

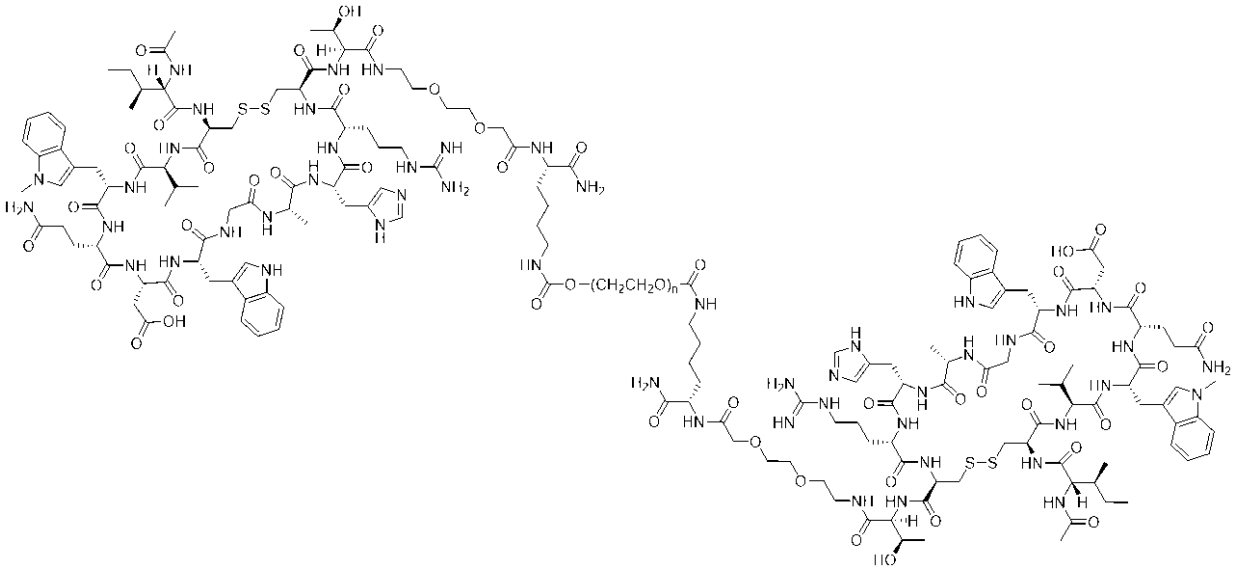
(ＣＨ２ＣＨ２Ｏ)ｎ部分の分子量は約１,０００；５,０００；１０,０００；２０,０００；３０,０００；４０,０００；５０,０００；６０,０００；７０,０００；８０,０００；９０,０００および１００,０００ダルトンである〕

を有する、長時間作用型コンプスタチン類似体。

【請求項１４】

次の構造：

【化５】



〔式中、$(CH_2CH_2O)_n$部分の分子量は約４０,０００ダルトンである〕
を有する、請求項１３に記載の長時間作用型コンプスタチン類似体。
【請求項１５】
$(CH_2CH_2O)_n$部分の平均分子量が、約２０kD～１００kD、約２０kD～９０kD、約２０kD～８０kD、約２０kD～７０kD、約２０kD～６０kD、約２０kD～５０kD、約３０kD～８０kD、約３０kD～７０kD、約３０kD～６０kD、約３０kD～５０kD、約３０kD～４５kD、約３５～５０kD、約３５～４５kD、約３６～４４kD、約３７～４３kD、約３８～４２kDまたは約３９～４１kDである、請求項１３または１４に記載の長時間作用型コンプスタチン類似体。
【請求項１６】
$(CH_2CH_2O)_n$部分の多分散度が１、または１.００５～１.１５、または１.００５～１.２０、または１.００５～１.２５、または１.００５～１.３０、または１.００５～１.４０もしくは１.５０、または１.００５～１.５０の間である、請求項１３～１５のいずれか一項に記載の長時間作用型コンプスタチン類似体。
【請求項１７】
請求項１３～１６のいずれか一項に記載の長時間作用型コンプスタチン類似体および薬学的に許容される担体を含む、組成物。
【請求項１８】
医薬として使用するための、請求項１７に記載の組成物。
【請求項１９】
細胞または臓器の補体依存性傷害に対する感受性を低下させることに使用するための、請求項１７に記載の組成物。
【請求項２０】
補体介在性障害の処置に使用するための、請求項１７に記載の組成物。
【請求項２１】
加齢黄斑変性症(ＡＭＤ)の地図状萎縮(ＧＡ)の処置または予防に使用するための、請求項１７に記載の組成物。
【請求項２２】
対象の眼に投与されるものである、請求項２１に記載の組成物。
【請求項２３】
硝子体内投与されるものである、請求項２１に記載の組成物。
【請求項２４】
移植拒絶反応、虚血／再灌流傷害、溶血性貧血、自己免疫疾患、神経障害性疼痛、膜性

増殖性糸球体腎炎、視神経脊髄炎、脊髄損傷、喘息、発作性夜間血色素尿症(ＰＮＨ)または慢性閉塞性肺疾患(ＣＯＰＤ)の処置に使用するための、請求項１７に記載の組成物。
【請求項２５】
皮下投与または静脈内投与により投与されるものである、請求項１８～２０および２４のいずれか一項に記載の使用のための組成物。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０２８８
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０２８８】
ある態様において、細胞反応性、長時間作用型または標的化コンプスタチン類似体を用いて、膜性増殖性糸球体腎炎(ＭＰＧＮ)、例えば、Ｉ型ＭＰＧＮ、II型ＭＰＧＮまたはIII型ＭＰＧＨに罹患している、あるいは膜性増殖性糸球体腎炎のリスクのある対象を処置する。