

【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20年12月18日(2008.12.18)

【公表番号】特表2008-519858(P2008-519858A)

【公表日】平成20年6月12日(2008.6.12)

【年通号数】公開・登録公報2008-023

【出願番号】特願2007-541390(P2007-541390)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|-------|-----------|
| C 0 7 K | 7/08 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 38/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 13/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 31/18 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 37/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 7/06 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/48 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |

【F I】

| | | |
|---------|-------|-------|
| C 0 7 K | 7/08 | Z N A |
| A 6 1 K | 37/02 | |
| A 6 1 P | 13/12 | |
| A 6 1 P | 31/18 | |
| A 6 1 P | 37/02 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 7/06 | |
| A 6 1 K | 47/48 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 1 1 |

【手続補正書】

【提出日】平成20年10月31日(2008.10.31)

【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】

図1 A～1Kに記載の配列番号1～668から選択されるアミノ酸配列を含むペプチド。

【請求項2】

前記ペプチドのN末端がアセチル化されている、請求項1に記載のペプチド。

【請求項3】

前記ペプチドがモノマーである、請求項1に記載のペプチド。

【請求項4】

前記ペプチドがダイマーである、請求項1に記載のペプチド。

【請求項5】

前記ペプチドがホモダイマーである、請求項4に記載のペプチド。

【請求項6】

前記ペプチドに共有結合する1種以上の水溶性ポリマーをさらに含む、請求項1に記載のペプチド。

【請求項 7】

前記水溶性ポリマーがポリエチレングリコール(PEG)である、請求項6に記載のペプチド。

【請求項 8】

前記PEGが約500ダルトン～約60,000ダルトンの分子量を有する直鎖状の非分岐分子を含む、請求項7に記載のペプチド。

【請求項 9】

前記PEGが約20,000ダルトン未満の分子量を有する、請求項8に記載のペプチド。

【請求項 10】

前記PEGが約20,000ダルトン～約60,000ダルトンの分子量を有する、請求項8に記載のペプチド。

【請求項 11】

前記PEGが約20,000ダルトン～約40,000ダルトンの分子量を有する、請求項8に記載のペプチド。

【請求項 12】

2つのPEG部分が前記ペプチドに共有結合し、該PEGの各々は直鎖状の非分岐分子を含む、請求項8に記載のペプチド。

【請求項 13】

前記PEGの各々が約20,000ダルトン～約30,000ダルトンの分子量を有する、請求項12に記載のペプチド。

【請求項 14】

前記ペプチドがエリスロポエチンレセプター(EPO-R)に結合し、エリスロポエチンレセプターを活性化する、請求項1に記載のペプチド。

【請求項 15】

(a) 第1のペプチド鎖；

(b) 第2のペプチド鎖；および

(c) 該第1のペプチド鎖と第2のペプチド鎖とをつなぐ連結部分を含むペプチドダイマーであって、

該第1のペプチド鎖および該第2のペプチド鎖の少なくとも1つは、図1A～1Kに記載の配列番号1～668から選択されるアミノ酸配列を含み、該ペプチドは、エリスロポエチンレセプター(EPO-R)に結合し、エリスロポエチンレセプターを活性化する、ペプチドダイマー。

【請求項 16】

前記連結部分が、式：

-NH-R₃-NH-

を含み、式中、R₃は低級(C₁₋₆)アルキレンである、請求項15に記載のペプチドダイマー。

【請求項 17】

前記連結部分がリジン残基である、請求項16に記載のペプチドダイマー。

【請求項 18】

前記連結部分が、式：

-CO-(CH₂)_n-X-(CH₂)_m-CO-

を含み、式中、nは0～10の整数であり、mは1～10の整数であり、Xは、O、S、N(CH₂)_pNR₁、NCO(CH₂)_pNR₁、およびCHNR₁から選択され、R₁は、H、Boc、およびCbzから選択され、そしてpは1から10の整数である、請求項15に記載のペプチドダイマー。

【請求項 19】

nおよびmが各々1であり、XはNCO(CH₂)_pNR₁であり、pは2であり、そしてR₁はHである、請求項18に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 0】

水溶性ポリマーをさらに含む、請求項 1 5 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 1】

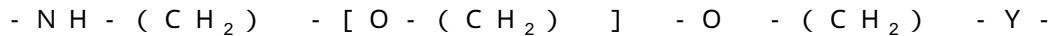
前記水溶性ポリマーが、リンカー部分に共有結合している、請求項 2 0 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 2】

スペーサー部分をさらに含む、請求項 1 5 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 3】

前記スペーサー部分が、式：



を含み、式中、 N 、 O および Y は、各々、1～6 から独立して選択される値の整数であり、 N は0または1であり、 O は0～10 から選択される整数であり、そして Y は、 NH または CO から選択され、但し、 Y が1よりも大きい場合、 Y は2である、請求項 2 2 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 4】

N 、 O および Y の各々が2であり、 N および O の各々が1であり、そして Y が NH である、請求項 2 3 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 5】

1種以上の水溶性ポリマーをさらに含む、請求項 2 2 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 6】

前記水溶性ポリマーが前記スペーサー部分に共有結合している、請求項 2 5 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 7】

前記水溶性ポリマーがポリエチレングリコール(PEG)である、請求項 2 0 または 2 5 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 8】

前記PEGが、約500ダルトン～約60,000ダルトンの分子量を有する直鎖状の非分岐PEGである、請求項 2 7 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 2 9】

前記PEGが、約500ダルトン～約20,000ダルトン未満の分子量を有する、請求項 2 8 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 3 0】

前記PEGが、約20,000ダルトン～60,000ダルトンの分子量を有する、請求項 2 8 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 3 1】

前記PEGが、約20,000ダルトン～約40,000ダルトンの分子量を有する、請求項 3 0 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 3 2】

2つのPEG部分が、前記ペプチドに共有結合しており、該PEGの各々は直鎖状の非分岐分子を含む、請求項 2 7 に記載のペプチド。

【請求項 3 3】

前記PEGの各々が、約20,000ダルトン～約30,000ダルトンの分子量を有する、請求項 3 2 に記載のペプチド。

【請求項 3 4】

エリスロポエチンの欠損、または低赤血球集団もしくは欠陥赤血球集団によって特徴付けられる障害を有する患者を処置するための医薬組成物の製造における、図1A～1Kに記載の配列番号1～668から選択されるアミノ酸配列を含むペプチドの使用。

【請求項 3 5】

前記障害が、末期腎不全または透析； AIDS、自己免疫疾患または悪性疾患に関連する貧血； - サラセミア； 囊胞性線維症； 未熟児の初期貧血； 慢性炎症疾患に関連する貧血

; 脊髄損傷; 急性失血; 加齢; ならびに異常な赤血球生成に伴う腫瘍性疾患状態から選択される、請求項 3 4 に記載の使用。

【請求項 3 6】

前記ペプチドがモノマーである、請求項 3 4 に記載の使用。

【請求項 3 7】

前記ペプチドがダイマーである、請求項 3 4 に記載の使用。

【請求項 3 8】

前記ペプチドがホモダイマーである、請求項 3 7 に記載の使用。

【請求項 3 9】

1種以上の水溶性ポリマーが、前記ペプチドに共有結合している、請求項 3 4 に記載の使用。

【請求項 4 0】

前記水溶性ポリマーが、ポリエチレングリコール（PEG）である、請求項 3 9 に記載の使用。

【請求項 4 1】

前記PEGが約500ダルトン～約60,000ダルトンの分子量を有する直鎖状の非分岐PEGである、請求項 4 0 に記載の使用。

【請求項 4 2】

前記PEGが約500ダルトン～約20,000ダルトン未満の分子量を有する、請求項 4 1 に記載の使用。

【請求項 4 3】

前記PEGが約20,000ダルトン～60,000ダルトンの分子量を有する、請求項 4 1 に記載の使用。

【請求項 4 4】

前記PEGが約20,000ダルトン～約40,000ダルトンの分子量を有する、請求項 4 3 に記載の使用。

【請求項 4 5】

2つのPEG部分が、前記ペプチドに共有結合しており、該PEGの各々は直鎖状の非分岐分子を含む、請求項 4 0 に記載の使用。

【請求項 4 6】

前記PEGの各々が、約20,000ダルトン～約30,000ダルトンの分子量を有する、請求項 4 5 に記載の使用。

【請求項 4 7】

(i) 図1A～1Kに記載の配列番号1～668から選択されるアミノ酸配列を含むペプチド；および(ii)薬学的に受容可能なキャリアを含有する、医薬組成物。

【請求項 4 8】

前記ペプチドがモノマーである、請求項 4 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 9】

前記ペプチドがダイマーである、請求項 4 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 0】

前記ペプチドがホモダイマーである、請求項 4 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 1】

1種以上の水溶性ポリマーが、前記ペプチドに共有結合している、請求項 5 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 2】

前記水溶性ポリマーが、ポリエチレングリコール（PEG）である、請求項 5 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 3】

前記PEGが、約500ダルトン～約60,000ダルトンの分子量を有する直鎖状の非分岐PEGである、請求項 5 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 4】

前記 P E G が、約 5 0 0 ダルトン～約 2 0 , 0 0 0 ダルトン未満の分子量を有する、請求項 5 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 5】

前記 P E G が、約 2 0 , 0 0 0 ダルトン～約 6 0 , 0 0 0 ダルトンの分子量を有する、請求項 5 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 6】

前記 P E G が、約 2 0 , 0 0 0 ダルトン～約 4 0 , 0 0 0 ダルトンの分子量を有する、請求項 5 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 7】

2 つの P E G 部分が、前記ペプチドに共有結合しており、該 P E G の各々は、直鎖状の非分岐分子を含む、請求項 5 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 8】

前記 P E G の各々が、約 2 0 , 0 0 0 ダルトン～3 0 , 0 0 0 ダルトンの分子量を有する、請求項 5 7 に記載の医薬組成物。