

【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 ~ 1 K に記載の配列番号 1 ~ 6 6 8 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】

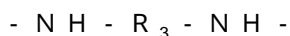
前記ペプチドがエリスロポエチンレセプター（EPO-R）に結合し、エリスロポエチンレセプターを活性化する、請求項 1 に記載のペプチド。

【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 1 A～1 K 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：



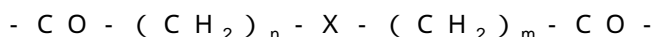
を含み、式中、 R_3 は低級（ C_{1-6} ）アルキレンである、請求項 15 に記載のペプチドダイマー。

【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：



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、 $N(CH_2)_pNR_1$ 、 $NCO(CH_2)_pNR_1$ 、および $CHNR_1$ から選択され、 R_1 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 $NCO(CH_2)_pNR_1$ であり、 p は 2 であり、そして R_1 は H である、請求項 18 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 20】

水溶性ポリマーをさらに含む、請求項 15 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 21】

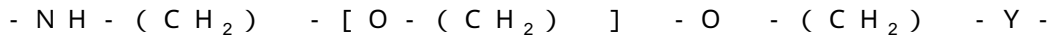
前記水溶性ポリマーが、リンカー部分に共有結合している、請求項 20 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 22】

スペーサー部分をさらに含む、請求項 15 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 23】

前記スペーサー部分が、式：



を含み、式中、 x 、 y および z 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、 y 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、 x が 1 よりも大きい場合、 z は 2 である、請求項 22 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 24】

x 、 y および z の各々が 2 であり、 n および y の各々が 1 であり、そして Y が NH である、請求項 23 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 25】

1 種以上の水溶性ポリマーをさらに含む、請求項 22 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 26】

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 25 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 27】

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 20 または 25 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 28】

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 27 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 29】

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 28 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 30】

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 28 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 31】

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 30 に記載のペプチドダイマー。

【請求項 32】

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 27 に記載のペプチド。

【請求項 33】

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 32 に記載のペプチド。

【請求項 34】

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 35】

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； β -サラセミア；嚢胞性線維症；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 5 0 0 ダルトン～約 6 0 , 0 0 0 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 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 4 1 に記載の使用。

【請求項 4 3】

前記 PEG が約 2 0 , 0 0 0 ダルトン～6 0 , 0 0 0 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 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 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 2 0 , 0 0 0 ダルトン～約 3 0 , 0 0 0 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 1 A～1 K に記載の配列番号 1～6 6 8 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 5 0 0 ダルトン～約 6 0 , 0 0 0 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。