

【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3区分

【発行日】平成19年3月1日(2007.3.1)

【公表番号】特表2006-517995(P2006-517995A)

【公表日】平成18年8月3日(2006.8.3)

【年通号数】公開・登録公報2006-030

【出願番号】特願2006-502450(P2006-502450)

【国際特許分類】

C 0 8 G 65/333 (2006.01)

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

A 6 1 P 5/10 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【F I】

C 0 8 G 65/333

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 5/10

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成19年1月9日(2007.1.9)

【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】

ポリエチレングリコール(PEG)の活性化エステルを製造する方法であって、適切な条件下でPEGをN,N'-ジスクシンイミジルオキサレート又は1,1'-ビス[6-(トリフルオロメチル)ベンゾトリアゾリル]オキサレートで活性化する工程を含む、前記方法。

【請求項2】

N,N'-ジスクシンイミジルオキサレート又は1,1'-ビス[6-(トリフルオロメチル)ベンゾトリアゾリル]オキサレートとPEGの割合が30:1以下である、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

触媒として有機塩基を用いる、請求項1または2に記載のポリエチレングリコール(PEG)の活性化エステルを製造する方法。

【請求項4】

前記触媒として用いる塩基がピリジン及びN,N'-4-ジメチルアミノピリジンからなる群から選択される、請求項3に記載のポリエチレングリコール(PEG)の活性化エステルを製造する方法。

【請求項5】

PEG-求核剤接合体を製造する方法であって、請求項1に記載の方法で製造されたPEGの活性化エステルを、生物学的活性求核剤と、適切な条件下で反応させてPEG-求核剤接合体を形成する工程を含む、前記方法。

【請求項6】

PEG-リンカー-求核剤接合体を製造する方法であって、以下の工程:

(a) 請求項1に記載の方法で製造されたPEGの活性化エステルをリンカーと反応させ

る工程；及び

(b) 得られた PEG-リンカーを生物学的活性求核剤と適切な条件下で反応させて PEG-リンカ-求核剤接合体を形成する工程；
を含む、前記方法。

【請求項 7】

前記生物学的活性求核剤がペプチド又はタンパク質である、請求項 5 又は 6 に記載の方法。

【請求項 8】

前記 PEG の活性化エステルが、前記ペプチド又はタンパク質と、1~30 モルの活性化エステルと 1 モルのペプチド又はタンパク質のモル比率で反応する；あるいは、前記 PEG の活性化エステルが、前記リンカーと、1 モルの活性化エステルと 1~10 モルのリンカ-のモル比率で反応する、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

前記生物学的活性求核剤がペプチド又はタンパク質であり、PEG-リンカ-が N, N'-ジスクシンイミジルオキサレート又は 1, 1'-ビス [6-(トリフルオロメチル)ベンゾトリアゾリル] オキサレートで活性化され、次いでペプチド又はタンパク質と、1~30 モルの活性化 PEG-リンカ-と 1 モルのペプチド又はタンパク質のモル比率で反応させて PEG-リンカ-ペプチド接合体又は PEG-リンカ-タンパク質接合体を形成する、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 10】

請求項 5, 6, 7, 8 又は 9 のいずれかに記載の方法で製造された PEG-求核剤接合体又は PEG-リンカ-求核剤接合体であって、前記求核剤が hGH アンタゴニスト又は抗 TNF 抗体である、前記接合体。

【請求項 11】

前記 TNF 抗体が CDR-グラフト化、hTNF40-ベースの修飾 Fab である、請求項 10 に記載の接合体。

【請求項 12】

請求項 10 又は 11 のいずれかに記載の PEG-求核剤接合体又は PEG-リンカ-求核剤接合体を含む、組成物。

【請求項 13】

請求項 10 又は 11 のいずれかに記載の PEG-求核剤接合体又は PEG-リンカ-求核剤接合体を含む、成長疾患又は炎症関連疾患の治療のための医薬組成物。