

【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23年6月2日 (2011.6.2)

【公表番号】特表2011-512336(P2011-512336A)

【公表日】平成23年4月21日 (2011.4.21)

【年通号数】公開・登録公報2011-016

【出願番号】特願2010-546197(P2010-546197)

【国際特許分類】

C 0 7 K 14/53 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 14/53 Z N A

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 31/10

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月16日 (2011.2.16)

【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

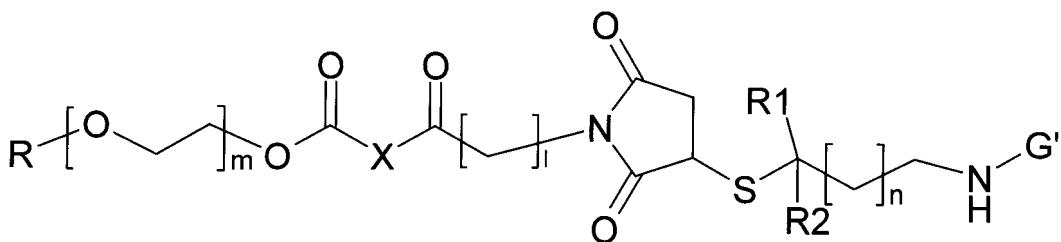
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I I) :

【化 1 5】



(II)

〔式中、

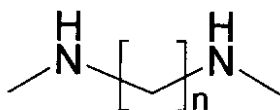
R は C_{1-4} の直鎖又は分岐アルキル基であり；

R 1 及び R 2 は、それぞれ独立して、水素原子又は C_{1-4} の直鎖もしくは分岐アルキル基であり；

—

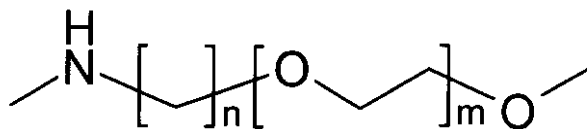
X は、O、S、NH、

【化 1 6】



又は

【化 1 7】



であり；

l は、1～20から選ばれる整数であり；

m は、50～2500から選ばれる整数であり；

n は、1～20から選ばれる整数であり；

G' は、天然型G-CSF、遺伝子組換え型G-CSF又はG-CSFの機能を有する遺伝子変異産物である。]

で表される複合体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

G' が、SEQ ID No. 1～10に示されるタンパク質のG-CSF誘導体から選ばれる、請求項 1 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

G' の配列が、天然に存在するヒトG-CSFの配列である、請求項 1 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩。

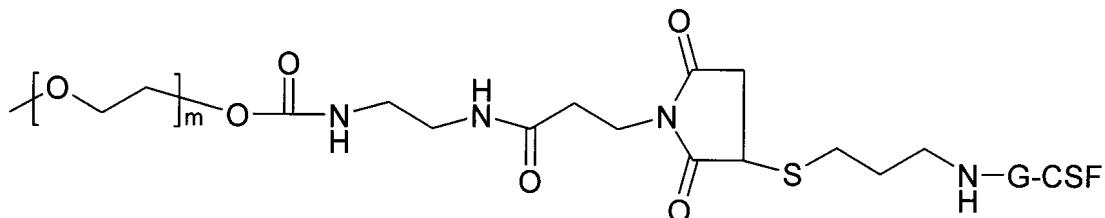
【請求項 4】

G' の配列が、SEQ ID No. 1に示されるMet-G-CSFである、請求項 1 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

複合体が、

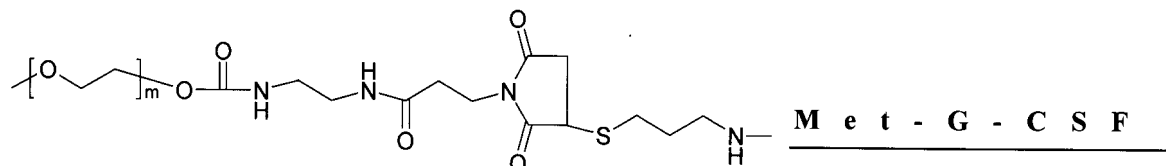
【化 1 8】



〔式中、mは400～500から選ばれる整数である。〕

及び、

【化 1 9】



〔式中、mは400～500から選ばれる整数である。〕

を含む、請求項 1 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

複合体が、酸と反応して塩を形成し、前記酸が有機酸及び無機酸から選ばれる、請求項 1 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

有機酸が、酢酸、トリフルオロ酢酸、プロピオン酸、酪酸、マレイン酸及びp-トルエンスルホン酸、並びにこれらの混合物から選ばれる請求項 6 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

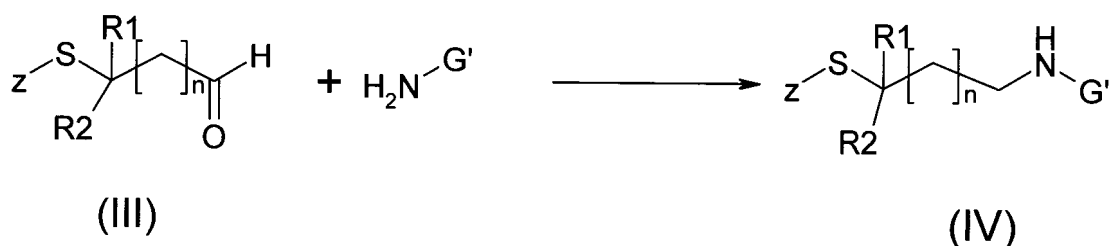
無機酸が、塩酸、硫酸、リン酸及びメタンスルホン酸並びにこれらの混合物から選ばれる請求項 6 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の複合体の製造方法であって、該製造方法が下記のステップを含む製造方法：

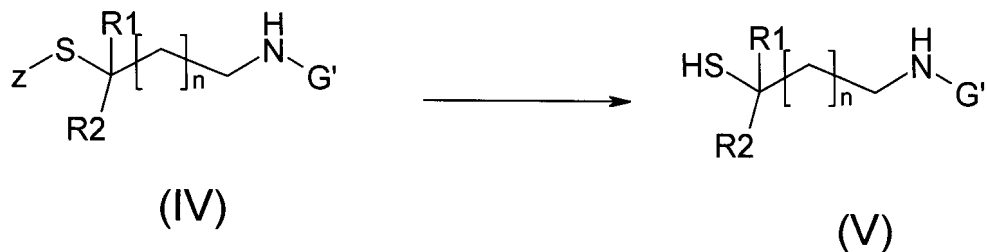
1) 一般式 (III) で表される化合物を、還元的アミノ化により G' の N 末端アミノ基と反応させ、一般式 (IV) で表される化合物を得るステップ：

【化 2 0】



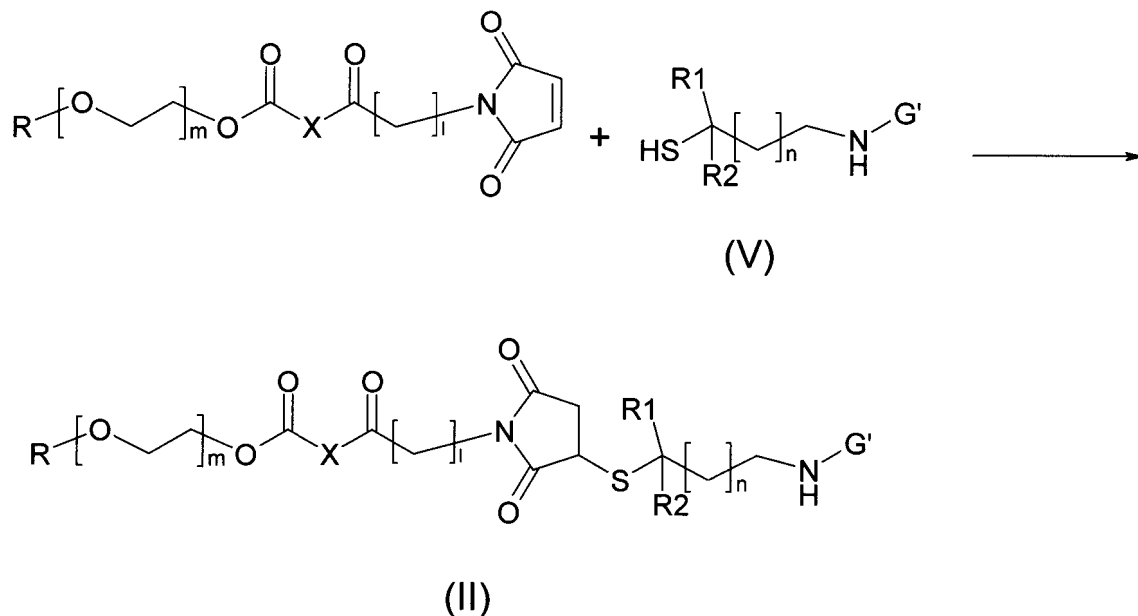
2) 一般式 (IV) で表される化合物からメルカプト保護基を除去し、一般式 (V) で表される化合物を得るステップ：

【化 2 1】



3) 一般式 (V) で表される化合物を、マイケル付加反応により mPEG-MAL と反応させ、化合物 (II) を得るステップ:

【化 2 2】



〔式中、

R、R1、R2、G'、X、l、m 及び n は、請求項 1 において定義される；

z は、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、トリチル基及び tert ブチル基から選ばれるメルカプト保護基である。〕。

【請求項 10】

放射線療法又は化学療法に起因する白血球減少症、AIDS 及びその他の免疫不全症である細菌感染を治療する薬物の製造における、請求項 1 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩の使用。

【請求項 11】

請求項 1 に記載の複合体又はその薬学的に許容される塩の薬学的な有効量、及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 12】

放射線療法又は化学療法に起因する白血球減少症、AIDS 及びその他の免疫不全症である細菌感染を治療する薬物の製造における、請求項 11 に記載の医薬組成物の使用。