

【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25年10月17日 (2013.10.17)

【公表番号】特表2013-501802(P2013-501802A)

【公表日】平成25年1月17日 (2013.1.17)

【年通号数】公開・登録公報2013-003

【出願番号】特願2012-524836(P2012-524836)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

C 0 7 K 5/107 (2006.01)

C 0 7 K 5/11 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 37/02 Z N A

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 3/04

C 0 7 K 5/107

C 0 7 K 5/11

【手続補正書】

【提出日】平成25年8月22日 (2013.8.22)

【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】

哺乳動物対象における代謝性症候群を治療し、又は予防するための医薬組成物であって、ペプチド：D - Arg - 2'6' - Dmt - Lys - Phe - NH<sub>2</sub>又はPhe - D - Arg - Phe - Lys - NH<sub>2</sub>を含む、医薬組成物。

【請求項 2】

前記代謝性症候群が、インシュリン - 媒介グルコース摂取、グルコース不耐性、高インシュリン血症、高LDL - コレステロール、高VLDL、高トリグリセライド、低HDL - コレステロール、高プラスミノーゲン活性化剤阻害剤 - 1 (PAI - 1) レベル又は高血圧と関連している、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記代謝性症候群が、以下の基準：

(a) 腹部肥満：男性におけるウエスト周 102cm、女性におけるウエスト周 88cm；

(b) 高トリグリセライド血症： 150mg / dL ( 1.695mM / L ) ；

(c) 低HDLコレステロール：男性において 40mg / dL ( 1.036mM / L ) 及び女性において 50 mg / dL ( 1.295mM / L ) 、

(d) 高血圧： 130 / 85mmHg ; 及び

(e) 高い空腹時のグルコース濃度： 110mg / dL ( 6.1mM / L )

の内の3つ又はそれ以上によって特徴付けられる、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記代謝性症候群が、糖尿病、不十分なグルコース耐性、不十分な空腹時のグルコース濃度、又はインシュリン抵抗性 + 以下に列挙する異常性：

(a) 高血圧： 160 / 90mmHg ;

(b) 高脂質血症：トリグリセライド濃度 150mg / dL ( 1.695mM / L ) 及び / 又はHDLコレステロール濃度：男性において 35mg / dL ( 0.9mM / L ) 及び女性において 39mg / dL ( 1.0mM / L ) ;

(c) 中心性肥満：男性において 0.90又は女性において 0.85なるウエスト対ヒップ比又はBMI： 30kg / m<sup>2</sup> ; 及び

(d) ミクロアルブミン尿症：尿アルブミン排泄率： 20 µg / 分又はアルブミン対クレアチニン比： 20mg / g

の内の2つ又はそれ以上によって特徴付けられる、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記代謝性症候群が、以下の基準：

(a) トリグリセライド： 150mg / dL ;

(b) 収縮期血圧 ( BP )： 130mmHg又は拡張期血圧： 85mmHg又は抗 - 高血圧症薬による治療中であること；

(c) 高密度リポタンパク質コレステロール： 40mg / dL ;

(d) 空腹時血糖値 ( FBS )： 110mg / dL ; 及び

(e) ボディマス指数： 28.8kg / m<sup>2</sup> ;

の内の3つ又はそれ以上によって特徴付けられる、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記代謝性症候群が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の脂質代謝に比して、脂質代謝を改善することを通して治療される、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記脂質代謝における改善が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の血中トリグリセライド濃度に対する、血中トリグリセライド濃度の低減である、請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記脂質代謝における改善が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の血中HDL / LDLコレステロール比に対する、血中HDL / LDLコレステロール比の改善である、請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記代謝性症候群が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の血糖値レベルに比して、血糖値レベルを減じることにより治療される、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記代謝性症候群が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の体重に比して、体重を減じることにより治療される、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記対象が、ヒトである、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記ペプチドが、II型糖尿病の発症前に投与される、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記ペプチドが、経口、全身的、静脈内、皮下、又は筋肉内経路で投与されるように処方される、請求項 1 記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記哺乳動物が、代謝性症候群の治療又は予防についてモニターされる、請求項 1 記載

の医薬組成物。

【請求項 15】

哺乳動物対象における代謝性症候群を治療し、又は予防するための医薬品の製造における組成物の使用であって、組成物は、治療上有効な量のペプチド：D - Arg - 2'6' - Dmt - Lys - Phe - NH<sub>2</sub>又はPhe - D - Arg - Phe - Lys - NH<sub>2</sub>を含む、使用。

【請求項 16】

前記代謝性症候群が、インシュリン - 媒介グルコース摂取、グルコース不耐性、高インシュリン血症、高LDL - コレステロール、高VLDL、高トリグリセライド、低HDL - コレステロール、高プラスミノゲン活性化剤阻害剤 - 1 (PAI - 1) レベル又は高血圧と関連している、請求項 15 記載の使用。

【請求項 17】

前記代謝性症候群が、以下の基準：

- (a) 腹部肥満：男性におけるウエスト周 102cm、女性におけるウエスト周 88cm；
- (b) 高トリグリセライド血症： 150mg / dL ( 1.695mM / L )；
- (c) 低HDLコレステロール：男性において 40mg / dL ( 1.036mM / L ) 及び女性において 50 mg / dL ( 1.295mM / L )、
- (d) 高血圧： 130 / 85mmHg；及び
- (e) 高い空腹時のグルコース濃度： 110mg / dL ( 6.1mM / L )

の内の3つ又はそれ以上によって特徴付けられる、請求項 15 記載の使用。

【請求項 18】

前記代謝性症候群が、糖尿病、不十分なグルコース耐性、不十分な空腹時のグルコース濃度、又はインシュリン抵抗性 + 以下に列挙する異常性：

- (a) 高血圧： 160 / 90mmHg；
- (b) 高脂質血症：トリグリセライド濃度 150mg / dL ( 1.695mM / L ) 及び / 又はHDLコレステロール濃度：男性において 35mg / dL ( 0.9mM / L ) 及び女性において 39mg / dL ( 1.0mM / L )；
- (c) 中心性肥満：男性において 0.90又は女性において 0.85なるウエスト対ヒップ比又はBMI： 30kg / m<sup>2</sup>；及び
- (d) ミクロアルブミン尿症：尿アルブミン排泄率： 20 µg / 分又はアルブミン対クレアチニン比： 20mg / g

の内の2つ又はそれ以上によって特徴付けられる、請求項 15 記載の使用。

【請求項 19】

前記代謝性症候群が、以下の基準：

- (a) トリグリセライド： 150mg / dL；
- (b) 収縮期血圧 (BP)： 130mmHg又は拡張期血圧： 85mmHg又は抗 - 高血圧症薬による治療中であること；
- (c) 高密度リポタンパク質コレステロール： 40mg / dL；
- (d) 空腹時血糖値 (FBS)： 110mg / dL；及び
- (e) ボディマス指数： 28.8kg / m<sup>2</sup>；

の内の3つ又はそれ以上によって特徴付けられる、請求項 15 記載の使用。

【請求項 20】

前記代謝性症候群が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の脂質代謝に比して、脂質代謝を改善することを通して治療される、請求項 15 記載の使用。

【請求項 21】

前記脂質代謝における改善が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の血中トリグリセライド濃度に対する、血中トリグリセライド濃度の低減である、請求項 20 記載の使用。

【請求項 22】

前記脂質代謝における改善が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の血中HDL / LDLコレステロール比に対する、血中HDL / LDLコレステロール比の改善である、請求項 20 記載の使用。

## 【請求項 23】

前記代謝性症候群が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の血糖値レベルに比して、血糖値レベルを減じることにより治療される、請求項 15 記載の 使用。

## 【請求項 24】

前記代謝性症候群が、前記ペプチドを投与する前の前記対象の体重に比して、体重を減じることにより治療される、請求項 15 記載の 使用。

## 【請求項 25】

前記対象が、ヒトである、請求項 15 記載の 使用。

## 【請求項 26】

前記ペプチドが、II型糖尿病の発症前に投与される、請求項 15 記載の 使用。

## 【請求項 27】

前記ペプチドが、経口、全身的、静脈内、皮下、又は筋肉内経路で投与される ように処方される、請求項 15 記載の 使用。

## 【請求項 28】

前記哺乳動物が、代謝性症候群の治療又は予防についてモニター される、請求項 15 記載の 使用。