

【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】令和5年12月8日(2023.12.8)

【公開番号】特開2023-126965(P2023-126965A)

【公開日】令和5年9月12日(2023.9.12)

【年通号数】公開公報(特許)2023-172

【出願番号】特願2023-112456(P2023-112456)

【国際特許分類】

C 07 K 14/575(2006.01)  
 A 61 K 38/16(2006.01)  
 A 61 K 47/54(2017.01)  
 A 61 K 9/08(2006.01)  
 A 61 P 3/00(2006.01)  
 A 61 P 3/10(2006.01)  
 A 61 K 45/00(2006.01)  
 A 61 P 3/06(2006.01)  
 A 61 P 3/04(2006.01)  
 A 61 P 9/00(2006.01)

10

【F I】

20

C 07 K 14/575 Z N A  
 A 61 K 38/16  
 A 61 K 47/54  
 A 61 K 9/08  
 A 61 P 3/00  
 A 61 P 3/10  
 A 61 K 45/00  
 A 61 P 3/06  
 A 61 P 3/04  
 A 61 P 9/00

30

【手続補正書】

【提出日】令和5年11月29日(2023.11.29)

【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】

40

一般式I:

R<sup>1</sup>-Z-R<sup>2</sup> (I)

により表されるG I P類似体

(式中、

R<sup>1</sup>は、H-、Ac又はpGluであり;

R<sup>2</sup>は、-NH<sub>2</sub>又は-OHであり;かつ、

Zは以下:

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K(ヘキサデカノイル-isGlu)-HQQDFVNWLAAQGPSS  
 GAPPPS;

Y-Aib-EGTFISDYSIELD-K(ヘキサデカノイル-isGlu)-IHQQDFVNWLAAQGPSS

50

GAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K (ヘキサデカノイル-isoGlu)-HQQDFVNWLQAQGPSS  
GAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLQAQGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLQAQGPSSGAPPS-K (ヘキサデカノイル-  
isoGlu) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLQAQ-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLQAQKG-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-HQQDFVNYLLAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-HQQDFVNWLQAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-AAQDFVNWLQAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-AAKEFVNWLQAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELEKIAQRAFVEWLLAQGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELEKIAQRAFVEWLLAQ-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-  
isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-AAQDFVNWLLAGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFVNWLLAGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ((19-カルボキシ-ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-  
イル)-アセチル]-Peg3-Peg3)-AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ((19-カルボキシ-ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-  
イル)-アセチル]-Peg3-Peg3)-AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ((19-カルボキシ-ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-  
イル)-アセチル]-Peg3-Peg3)-AQKEFVEWLLAAGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg  
3)-AQKEFVEWLLAAGPSSGAPPS ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQKEFIEWLLAGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFIEWLLAGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFIEWLLAGPSSGAPPS-K ((19-カルボキシ-  
ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-イル)-アセチル]-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFVEWLLAGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPS-K ([19-カルボキシ-  
ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;

ナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQAFVNWLLAGPSSGAPPPS ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQDFVNWLLAGPSSGAPPPS ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQDFINWLLAGPSSGAPPPS ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ((19-カルボキシ-ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-イル)-アセチル]-Peg3-Peg3)-AAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-IAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS ;  
 Y-Aib-EGTFISDYS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-ELDKIAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS ;  
 Y-DAla-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS ;  
 Y-DAla-EGTFISDYSIELDKKIAAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ((19-カルボキシ-ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-イル)-アセチル]-Peg3-Peg3) ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQDFIEWLLAQGPSSGAPPPS ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQDFINWLHQGPSSGAPPPS ;  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQAFIEWLLAQGPSSGAPPPS ; 及び  
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ((19-カルボキシ-ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-イル)-アセチル]-Peg3-Peg3)-AAQAFIEWLLAQGPSSGAPPPS ; から選択される)であって、GIP受容体においてアゴニスト活性を有するGIP類似体、あるいはその医薬的に許容し得る塩又は溶媒和物を含む、代謝障害の治療及び/又は予防の方法における使用のための医薬組成物。

10

20

30

40

50

## 【請求項2】

前記GIP類似体は、

H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K(ヘキサデカノイル-isoGlu)-HQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK(ヘキサデカノイル-isoGlu)-IHQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K(ヘキサデカノイル-isoGlu)-HQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-K([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-K(ヘキサデカノイル-isoGlu)-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-K(ヘキサデカノイル-isoGlu)-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-K(ヘキサデカノイル-isoGlu)-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-HQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-HQQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub>

H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AAQDFVNWLHQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AAKEFVNWLHQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEKIAQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEKIAQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AAQDFVNWLLAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFVNWLLAGPSSGAPPPS-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( ( 19-カルボキシ-ノナデカノイル ) -[ ( ピペラジン-1-イル ) -アセチル ] -Peg3-Peg3 ) -AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( ( 19-カルボキシ-ノナデカノイル ) -[ ( ピペラジン-1-イル ) -アセチル ] -Peg3-Peg3 ) -AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( ( 19-カルボキシ-ノナデカノイル ) -[ ( ピペラジン-1-イル ) -アセチル ] -Peg3-Peg3 ) -AQKEFVEWLLAAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AQKEFVEWLLAAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQKEFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ( ( 19-カルボキシ-ノナデカノイル ) -[ ( ピペラジン-1-イル ) -アセチル ] -Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFVEWLLAGPSSGAPPPS-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AAQAFVNWLLAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AAQDFVNWLLAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AAQDFINWLLAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -AAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ( ( 19-カルボキシ-ノナデカノイル ) -[ ( ピペラジン-1-イル ) -アセチル ] -Peg3-Peg3 ) -AAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK ( [ 19-カルボキシ-ノナデカノイル ] -isoGlu-Peg3-Peg3 ) -IAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub> ;

10

20

30

40

50

H-Y-Aib-EGTFISDYS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-ELDKIAQRafIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub>;  
 H-Y-DAla-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub>;  
 H-Y-DAla-EGTFISDYSIELDKIAAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ((19-カルボキシ-ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-イル)-アセチル]-Peg3-Peg3)-NH<sub>2</sub>;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQDFIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub>;  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3)-AAQDFINWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub>; 又は、  
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ((19-カルボキシ-ノナデカノイル)-[(ピペラジン-1-イル)-アセチル]-Peg3-Peg3)-AAQAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH<sub>2</sub>;  
 である、請求項1に記載の医薬組成物。  
 10

**【請求項3】**

抗糖尿病薬との併用療法の一部として投与される、請求項1又は2に記載の医薬組成物。

**【請求項4】**

G L P-1アゴニストとの併用療法の一部として投与される、請求項1又は2に記載の医薬組成物。 20

**【請求項5】**

前記代謝障害は、糖尿病又は糖尿病関連障害、又は肥満又は肥満関連障害である、請求項1~4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

**【請求項6】**

前記糖尿病関連障害は、インスリン抵抗性、耐糖能異常、空腹時グルコースの増加、低血糖(例えば、インスリン治療により誘発される)、糖尿病前症、1型糖尿病、2型糖尿病、妊娠糖尿病高血圧、脂質異常症、又はそれらの組み合わせである、請求項5に記載の医薬組成物。

**【請求項7】**

前記糖尿病関連障害は、アテローム性動脈硬化症、動脈硬化症、冠動脈性心疾患、末梢動脈疾患、又は脳卒中であるか、あるいは、アテローム性脂質異常症、血中脂質障害、血圧上昇、高血圧、血栓形成亢進状態、又は炎症亢進状態に関連する状態である、請求項5に記載の医薬組成物。 30

**【請求項8】**

前記糖尿病関連障害は、骨折のリスクの増加を含む骨粗鬆症である、請求項5に記載の医薬組成物。

**【請求項9】**

前記血中脂質障害は、高トリグリセリド、低HDLコレステロール、高LDLコレステロール、動脈壁におけるplaques蓄積、又はそれらの組み合わせである、請求項7に記載の医薬組成物。 40

**【請求項10】**

前記血栓形成亢進状態は、高レベルの血中フィブリノーゲン又は高レベルの血中プラスミノーゲン活性化因子インヒビター1を含む、請求項7に記載の医薬組成物。

**【請求項11】**

前記炎症亢進状態は、血中C反応性蛋白レベルの上昇を含む、請求項7に記載の医薬組成物。

**【請求項12】**

前記肥満関連障害は、肥満関連炎症、肥満関連胆囊疾患、又は肥満誘発性睡眠時無呼吸であるか、あるいは、アテローム性脂質異常症、血中脂質障害、血圧上昇、高血圧、血栓 50

形成亢進状態、及び炎症亢進状態から選択される状態に関連しうるか、あるいはそれらの組み合わせである、請求項5に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50