

【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)

10

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)

【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^1-Z-R^2 (I)

により表される G I P 類似体

(式中、

R^1 は、H-、Ac 又は pGlu であり ;

R^2 は、-NH₂ 又は -OH であり ; かつ、

Z は以下 :

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

Y-Aib-EGTFISDYSIELD-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) -IHQQDFVNWLLAQGPSS

50

GAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) -HQQDFVNWLLAQGPSS
 GAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-
 ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-K (ヘキサデカノイル-i
 soGlu) ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLLAQ-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLLAQKG-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) -HQQDFVNYLLAQGPSSGAPPPS ; 10
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg
 3) -HQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg
 3) -AAQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg
 3) -AAKEFVNWLLAQGPSSGAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg
 3) -AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELEKIAQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノ
 ナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ; 20
 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) -AAQDFVNWLLAGPSSGAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFVNWLLAGPSSGAPPPS-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) -AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg
 3) -AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS ; 30
 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 ;
 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 ;
 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 ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg
 3) -AQKEFVEWLLAAGPSSGAPPPS ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナ
 デカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ; 40
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQKEFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナ
 デカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナ
 デカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;
 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) ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFVEWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノ
 ナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノ 50

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) -AAQDFVNWLLAAGPSSGAPPPS ;
 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 ; 10
 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-DAIa-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) -AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS ;
 Y-DAIa-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) ;
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) -AAQDFIEWLLAQGPSSGAPPPS ; 20
 Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル]-isoGlu-Peg3-Peg3) -AAQDFINWLLAQGPSSGAPPPS ;
 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。 30

【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) -HQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) -IHQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) -HQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ; 40
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLLAQ-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIHQQDFVNWLLAQKG-K (ヘキサデカノイル-isoGlu) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -HQQDFVNYLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -HQQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ 50

H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AAQDFVNWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AAKEFVNWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEKIAQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELEKIAQRAFVEWLLAQ-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ; 10
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AAQDFVNWLLAGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFVNWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AQRAFVEWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 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-NH₂ ; 20
 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-NH₂ ;
 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-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AQKEFVEWLLAAGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQKEFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ; 30
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ;
 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) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAAQDFVEWLLAGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDKIAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AAQAFVNWLLAGPSSGAPPPS-NH₂ ; 40
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AAQDFVNWLLAAGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AAQDFINWLLAGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -AAQDFIEWLLAGPSSGAPPPS-NH₂ ;
 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-NH₂ ;
 H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3) -IAQRAFIEWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ; 50

H-Y-Aib-EGTFISDYS-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-Peg3)
-ELDKIAQRAFI EWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;

H-Y-DAIa-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3
-Peg3) -AQRAFI EWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;

H-Y-DAIa-EGTFISDYSIELDKIAAQDFI EWLLAGPSSGAPPPS-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) -NH₂ ;

H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-
Peg3) -AAQDFI EWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;

H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-
Peg3) -AAQDFINWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;

H-Y-Aib-EGTFISDYSIELDK-K ([19-カルボキシ-ノナデカノイル] -isoGlu-Peg3-
Peg3) -AAQAFI EWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ; 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) -AAQAFI EWLLAQGPSSGAPPPS-NH₂ ;

である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【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】

GLP-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。

【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。

【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、動脈壁におけるプラーク蓄積、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。

【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、肥満関連胆嚢疾患、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

10

20

30

40

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