

【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30年11月8日 (2018.11.8)

【公表番号】特表2017-531613(P2017-531613A)

【公表日】平成29年10月26日 (2017.10.26)

【年通号数】公開・登録公報2017-041

【出願番号】特願2017-500335(P2017-500335)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/16 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 5/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/64 (2017.01)

A 6 1 K 47/68 (2017.01)

A 6 1 K 47/65 (2017.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 38/16

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 5/14

A 6 1 K 47/64

A 6 1 K 47/68

A 6 1 K 47/65

A 6 1 K 39/395 Y

C 1 2 N 15/00 Z N A A

【手続補正書】

【提出日】平成30年9月27日 (2018.9.27)

【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】

上昇したトリグリセリド値を有する、またはそれを示す危険性がある対象のトリグリセリド値を低下させるための薬学的組成物であって、

全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 80 ~ 198 のアミノ酸配列に対して、少なくとも 85 % の配列同一性を有する連続するアミノ酸配列を含むポリペプチドを含み、

前記ポリペプチドが全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 21 ~ 70 を欠失しており、かつ

前記ポリペプチドが前記対象の前記トリグリセリド値を低下させるのに有効な量で対象に投与される、前記薬学的組成物。

【請求項 2】

前記連続するアミノ酸配列が、前記全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 8 0 ~ 1 9 8 のアミノ酸配列に対して少なくとも 9 0 % の配列同一性を有する、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3】

前記連続するアミノ酸配列が、前記全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 8 0 ~ 1 9 8 のアミノ酸配列に対して少なくとも 9 5 % の配列同一性を有する、請求項 1 ~ 2 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 4】

前記連続するアミノ酸配列が、前記全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 8 0 ~ 1 9 8 のアミノ酸配列に対して少なくとも 9 7 % の配列同一性を有する、請求項 1 ~ 2 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 5】

前記連続するアミノ酸配列が、前記全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 8 0 ~ 1 9 8 のアミノ酸配列に対して少なくとも 9 9 % の配列同一性を有する、請求項 1 ~ 2 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 6】

異種ポリペプチドが前記ポリペプチドの N 末端または C 末端にコンジュゲートされている、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 7】

前記異種ポリペプチドがアルブミンである、請求項 6 に記載の薬学的組成物。

【請求項 8】

前記異種ポリペプチドがヒト血清アルブミンである、請求項 6 または 7 に記載の薬学的組成物。

【請求項 9】

前記異種ポリペプチドが免疫グロブリン F c である、請求項 6 に記載の薬学的組成物。

【請求項 10】

前記異種ポリペプチドがリンカー配列を介して前記ポリペプチドにコンジュゲートされている、請求項 6 ~ 9 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 11】

前記リンカー配列が切断可能なリンカー配列である、請求項 10 に記載の薬学的組成物。

【請求項 12】

前記リンカー配列が非切断性リンカー配列である、請求項 10 に記載の薬学的組成物。

【請求項 13】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のトリグリセリド値と比較して、トリグリセリド値を少なくとも 5 % 低下させる、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 14】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のトリグリセリド値と比較して、トリグリセリド値を少なくとも 1 0 % 低下させる、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 15】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のトリグリセリド値と比較して、トリグリセリド値を少なくとも 2 0 % 低下させる、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 16】

前記対象が体重過多または肥満である、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 17】

前記対象が糖尿病を有する、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 18】

前記対象が甲状腺機能低下症を有する、請求項 1 ～ 15 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 19】

上昇した総コレステロール値を有する、またはそれを示す危険性がある対象の総コレステロール値を低下させるための薬学的組成物であって、

全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 80 ～ 198 のアミノ酸配列に対して、少なくとも 85 % の配列同一性を有する連続するアミノ酸配列を含むポリペプチドを含み、

前記ポリペプチドが全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 21 ～ 70 を欠失しており、かつ

前記ポリペプチドが前記対象の総コレステロール値を低下させるのに有効な量で対象に投与される、前記薬学的組成物。

【請求項 20】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の総コレステロール値と比較して、総コレステロール値を少なくとも 5 % 低下させる、請求項 19 に記載の薬学的組成物。

【請求項 21】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の総コレステロール値と比較して、総コレステロール値を少なくとも 10 % 低下させる、請求項 19 に記載の薬学的組成物。

【請求項 22】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の総コレステロール値と比較して、総コレステロール値を少なくとも 20 % 低下させる、請求項 19 に記載の薬学的組成物。

【請求項 23】

上昇した低密度リポタンパク質 (L D L) コレステロール値を有する、またはそれを示す危険性がある対象の L D L コレステロール値を低下させるための薬学的組成物であって、

全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 80 ～ 198 のアミノ酸配列に対して、少なくとも 85 % の配列同一性を有する連続するアミノ酸配列を含むポリペプチドを含み、

前記ポリペプチドが全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 21 ～ 70 を欠失しており、かつ

前記ポリペプチドが前記対象の L D L コレステロール値を低下させるのに有効な量で対象に投与される、前記方法。

【請求項 24】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の L D L コレステロール値と比較して、L D L コレステロール値を少なくとも 5 % 低下させる、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 25】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の L D L コレステロール値と比較して、L D L コレステロール値を少なくとも 10 % 低下させる、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 26】

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の L D L コレステロール値と比較して、L D L コレステロール値を少なくとも 20 % 低下させる、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 27】

前記連続するアミノ酸配列が、全長 A N G P T L 8 (配列番号 1) のアミノ酸 80 ～ 1

98のアミノ酸配列に対して少なくとも90%の配列同一性を有する、請求項19～26のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項28】

前記連続するアミノ酸配列が、全長ANGPTL8（配列番号1）のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも95%の配列同一性を有する、請求項19～26のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項29】

前記連続するアミノ酸配列が、全長ANGPTL8（配列番号1）のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも97%の配列同一性を有する、請求項19～26のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項30】

前記連続するアミノ酸配列が、全長ANGPTL8（配列番号1）のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも99%の配列同一性を有する、請求項19～26のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項31】

異種ポリペプチドが前記ポリペプチドのN末端またはC末端にコンジュゲートされている、請求項19～26のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項32】

前記異種ポリペプチドがアルブミンである、請求項31に記載の薬学的組成物。

【請求項33】

前記異種ポリペプチドがヒト血清アルブミンである、請求項31または32に記載の薬学的組成物。

【請求項34】

前記異種ポリペプチドが免疫グロブリンFcである、請求項31に記載の薬学的組成物。

【請求項35】

前記異種ポリペプチドがリンカー配列を介して前記ポリペプチドにコンジュゲートされている、請求項31～34のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項36】

前記リンカー配列が切断可能なリンカー配列である、請求項35に記載の薬学的組成物。

【請求項37】

前記リンカー配列が非切断性リンカー配列である、請求項36に記載の薬学的組成物。

【請求項38】

前記対象が体重過多である、請求項19～37のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項39】

前記対象が肥満である、請求項19～37のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項40】

前記対象が糖尿病を有する、請求項19～37のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項41】

前記対象が甲状腺機能低下症を有する、請求項19～37のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0022】

例示の対象は、体重過多、肥満である、糖尿病を有する、甲状腺機能低下症、心臓血管疾患またはこれらの症状の組み合わせを有する対象を含む。

[本発明1001]

上昇したトリグリセリド値を有する、またはそれを示す危険性がある対象のトリグリセリド値を低下させる方法であって、

全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して、少なくとも85%の配列同一性を有する連続するアミノ酸配列を含むポリペプチドを前記対象に投与することを含み、

前記ポリペプチドが全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸21～70を欠失しており、かつ

前記ポリペプチドが前記対象の前記トリグリセリド値を低下させるのに有効な量で投与される、前記方法。

[本発明1002]

前記連続するアミノ酸配列が、前記全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも90%の配列同一性を有する、本発明1001の方法。

[本発明1003]

前記連続するアミノ酸配列が、前記全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも95%の配列同一性を有する、本発明1001～1002のいずれかの方法。

[本発明1004]

前記連続するアミノ酸配列が、前記全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも97%の配列同一性を有する、本発明1001～1002のいずれかの方法。

[本発明1005]

前記連続するアミノ酸配列が、前記全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも99%の配列同一性を有する、本発明1001～1002のいずれかの方法。

[本発明1006]

異種ポリペプチドが前記ポリペプチドのN末端またはC末端にコンジュゲートされている、本発明1001～1005のいずれかの方法。

[本発明1007]

前記異種ポリペプチドがアルブミンである、本発明1006の方法。

[本発明1008]

前記異種ポリペプチドがヒト血清アルブミンである、本発明1006または1007の方法。

[本発明1009]

前記異種ポリペプチドが免疫グロブリンFcである、本発明1006の方法。

[本発明1010]

前記異種ポリペプチドがリンカー配列を介して前記ポリペプチドにコンジュゲートされている、本発明1006～1009のいずれかの方法。

[本発明1011]

前記リンカー配列が切断可能なリンカー配列である、本発明1010の方法。

[本発明1012]

前記リンカー配列が非切断性リンカー配列である、本発明1010の方法。

[本発明1013]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のトリグリセリド値と比較して、トリグリセリド値を少なくとも5%低下させる、本発明1001～1012のいずれかの方法。

[本発明1014]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のトリグリセリド値と比較して、トリグリセリド値を少なくとも10%低下させる、本発明1001～1013のいずれかの方法。

[本発明1015]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のトリグリセリド値と比較して、トリグリセリド値を少なくとも20%低下させる、本発明1001~1014のいずれかの方法。

[本発明1016]

前記対象が体重過多または肥満である、本発明1001~1015のいずれかの方法。

[本発明1017]

前記対象が糖尿病を有する、本発明1001~1015のいずれかの方法。

[本発明1018]

前記対象が甲状腺機能低下症を有する、本発明1001~1015のいずれかの方法。

[本発明1019]

上昇した総コレステロール値を有する、またはそれを示す危険性がある対象の総コレステロール値を低下させる方法であって、

全長A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80~198のアミノ酸配列に対して、少なくとも85%の配列同一性を有する連続するアミノ酸配列を含むポリペプチドを前記対象に投与することを含み、

前記ポリペプチドが全長A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸21~70を欠失しており、かつ

前記ポリペプチドが前記対象の総コレステロール値を低下させるのに有効な量で投与される、前記方法。

[本発明1020]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の総コレステロール値と比較して、総コレステロール値を少なくとも5%低下させる、本発明1019の方法。

[本発明1021]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の総コレステロール値と比較して、総コレステロール値を少なくとも10%低下させる、本発明1019の方法。

[本発明1022]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象の総コレステロール値と比較して、総コレステロール値を少なくとも20%低下させる、本発明1019の方法。

[本発明1023]

上昇した低密度リポタンパク質 (L D L) コレステロール値を有する、またはそれを示す危険性がある対象のL D L コレステロール値を低下させる方法であって、

全長A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80~198のアミノ酸配列に対して、少なくとも85%の配列同一性を有する連続するアミノ酸配列を含むポリペプチドを前記対象に投与することを含み、

前記ポリペプチドが全長A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸21~70を欠失しており、かつ

前記ポリペプチドが前記対象のL D L コレステロール値を低下させるのに有効な量で投与される、前記方法。

[本発明1024]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のL D L コレステロール値と比較して、L D L コレステロール値を少なくとも5%低下させる、本発明1023の方法

。

[本発明1025]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のL D L コレステロール値と比較して、L D L コレステロール値を少なくとも10%低下させる、本発明1023の方法

。

[本発明1026]

前記投与することが、前記ポリペプチドの投与の前の前記対象のL D L コレステロール値と比較して、L D L コレステロール値を少なくとも20%低下させる、本発明1023の方法

。

[本発明1027]

前記連続するアミノ酸配列が、全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも90%の配列同一性を有する、本発明1019～1026のいずれかの方法。

[本発明1028]

前記連続するアミノ酸配列が、全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも95%の配列同一性を有する、本発明1019～1026のいずれかの方法。

[本発明1029]

前記連続するアミノ酸配列が、全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも97%の配列同一性を有する、本発明1019～1026のいずれかの方法。

[本発明1030]

前記連続するアミノ酸配列が、全長 A N G P T L 8 (配列番号1) のアミノ酸80～198のアミノ酸配列に対して少なくとも99%の配列同一性を有する、本発明1019～1026のいずれかの方法。

[本発明1031]

異種ポリペプチドが前記ポリペプチドのN末端またはC末端にコンジュゲートされている、本発明1019～1026のいずれかの方法。

[本発明1032]

前記異種ポリペプチドがアルブミンである、本発明1031の方法。

[本発明1033]

前記異種ポリペプチドがヒト血清アルブミンである、本発明1031または1032の方法。

[本発明1034]

前記異種ポリペプチドが免疫グロブリンFcである、本発明1031の方法。

[本発明1035]

前記異種ポリペプチドがリンカー配列を介して前記ポリペプチドにコンジュゲートされている、本発明1031～1034のいずれかの方法。

[本発明1036]

前記リンカー配列が切断可能なリンカー配列である、本発明1035の方法。

[本発明1037]

前記リンカー配列が非切断性リンカー配列である、本発明1036の方法。

[本発明1038]

前記対象が体重過多である、本発明1019～1037のいずれかの方法。

[本発明1039]

前記対象が肥満である、本発明1019～1037のいずれかの方法。

[本発明1040]

前記対象が糖尿病を有する、本発明1019～1037のいずれかの方法。

[本発明1041]

前記対象が甲状腺機能低下症を有する、本発明1019～1037のいずれかの方法。