

【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28年6月23日 (2016.6.23)

【公表番号】特表2015-517459(P2015-517459A)

【公表日】平成27年6月22日 (2015.6.22)

【年通号数】公開・登録公報2015-040

【出願番号】特願2015-509461(P2015-509461)

【国際特許分類】

C 07 K 14/605 (2006.01)

C 12 N 1/15 (2006.01)

C 12 N 1/19 (2006.01)

C 12 N 1/21 (2006.01)

C 12 N 5/10 (2006.01)

C 12 N 15/09 (2006.01)

C 07 K 14/575 (2006.01)

A 61 K 38/22 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 5/50 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/14 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 11/16 (2006.01)

A 61 K 31/7088 (2006.01)

A 61 K 48/00 (2006.01)

A 61 K 35/76 (2015.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

【 F I 】

C 07 K 14/605

C 12 N 1/15 Z N A

C 12 N 1/19

C 12 N 1/21

C 12 N 5/00 1 0 1

C 12 N 15/00 A

C 07 K 14/575

A 61 K 37/24

A 61 P 3/10

A 61 P 3/04

A 61 P 5/50

A 61 P 9/12

A 61 P 3/06

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 9/10

A 61 P 9/14

A 61 P 29/00

A 61 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 11/16  
 A 6 1 K 31/7088  
 A 6 1 K 48/00  
 A 6 1 K 35/76  
 A 6 1 P 1/04

## 【手続補正書】

【提出日】平成28年4月28日(2016.4.28)

## 【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' :

R<sup>1</sup> - Tyr - X<sub>2</sub> - X<sub>3</sub> - Gly - Thr - Phe - X<sub>7</sub> - Ser - X<sub>9</sub> - X<sub>10</sub> - X<sub>11</sub> - X<sub>12</sub> - X<sub>13</sub> - X<sub>14</sub> - X<sub>15</sub> - X<sub>16</sub> - Lys - Ala - X<sub>19</sub> - X<sub>20</sub> - X<sub>21</sub> - X<sub>22</sub> - X<sub>23</sub> - X<sub>24</sub> - Trp - Leu - X<sub>27</sub> - X<sub>28</sub> - X<sub>29</sub> - X<sub>30</sub> - X<sub>31</sub> - X<sub>32</sub> - X<sub>33</sub> - X<sub>34</sub> - X<sub>35</sub> - X<sub>36</sub> - X<sub>37</sub> - X<sub>38</sub> - X<sub>39</sub> - X<sub>40</sub> - X<sub>41</sub> - X<sub>42</sub> - R<sup>2</sup> (I') (配列番号61)

[式中、

R<sup>1</sup> が Hy -、Ac 又は pGlu であり；  
 X<sub>2</sub> が Ala、Aib 又は Gly であり；  
 X<sub>3</sub> が Glu 又は Asp であり；  
 X<sub>7</sub> が Thr、Ser 又は Ile であり；  
 X<sub>9</sub> が Asp 又は Glu であり；  
 X<sub>10</sub> が Tyr、Leu 又は Ser であり；  
 X<sub>11</sub> が Ser 又は Leu であり；  
 X<sub>12</sub> が Ile 又は Lys であり；  
 X<sub>13</sub> が Ala、Tyr 又は Aib であり；  
 X<sub>14</sub> が Met、Leu 又は Ser であり；  
 X<sub>15</sub> が Asp 又は Glu であり；  
 X<sub>16</sub> が Lys、Gly、Ser 又は Glu であり；  
 X<sub>19</sub> が Gln、Ala、Glu 又は Lys であり；  
 X<sub>20</sub> が Gln、Lys、Arg 又は His であり；  
 X<sub>21</sub> が Asp、Ala 又は Glu であり；  
 X<sub>22</sub> が Phe 又は 1NaI であり；  
 X<sub>23</sub> が Val、Ile 又は Leu であり；  
 X<sub>24</sub> が Asn、Glu、Arg 又は Lys であり；  
 X<sub>27</sub> が Leu、Val、Ile、Lys、Glu 又は Ser であり；  
 X<sub>28</sub> が Ala、Ser、Arg 又は Aib であり；  
 X<sub>29</sub> が Gln、Aib、Lys、Gly 又は Ala であり；  
 X<sub>30</sub> が Lys、Gly、Pro 又は存在せず；  
 X<sub>31</sub> が Gly、Pro、Ser、Glu 又は存在せず；  
 X<sub>32</sub> が Lys、Ser 又は存在せず；  
 X<sub>33</sub> が Lys、Ser、Glu 又は存在せず；  
 X<sub>34</sub> が Asn、Gly、Ala、Lys 又は存在せず；  
 X<sub>35</sub> が Asp、Ala、Pro、Glu 又は存在せず；  
 X<sub>36</sub> が Trp、Pro、Lys 又は存在せず；

X 3 7 が L y s、P r o、G l u 又は存在せず；  
 X 3 8 が H i s、P r o、S e r、L y s 又は存在せず；  
 X 3 9 が A s n、S e r 又は存在せず；  
 X 4 0 が I l e 又は存在せず；  
 X 4 1 が T h r 又は存在せず；  
 X 4 2 が G l n 又は存在せず；そして  
 $R^2$  が  $-NH_2$  又は  $OH$  である]

により表される G I P アナログであって、

G I P 及び G L P - 1 受容体においてアゴニスト活性を有する前記アナログ又はこれらの  
 医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 2】

前記 G I P アナログが、一般式 I ( b ) '：

$R^1 - Tyr - X2 - X3 - Gly - Thr - Phe - X7 - Ser - X9 - X10 - X$   
 $11 - X12 - X13 - X14 - X15 - X16 - Lys - Ala - X19 - X20 - X$   
 $21 - Phe - X23 - X24 - Trp - Leu - X27 - X28 - X29 - X30 - X$   
 $31 - X32 - X33 - X34 - X35 - X36 - X37 - X38 - X39 - X40 - X$   
 $41 - X42 - R^2 ( I ( b ) ' )$  (配列番号 63)

[式中、

$R^1$  が H y -、A c 又は p G l u であり；  
 X 2 が A l a、A i b 又は G l y であり；  
 X 3 が G l u 又は A s p であり；  
 X 7 が T h r 又は S e r であり；  
 X 9 が A s p 又は G l u であり；  
 X 10 が T y r 又は L e u であり；  
 X 11 が S e r 又は L e u であり；  
 X 12 が I l e 又は L y s であり；  
 X 13 が A l a、T y r 又は A i b であり；  
 X 14 が L e u 又は S e r であり；  
 X 15 が A s p 又は G l u であり；  
 X 16 が L y s、S e r 又は G l u であり；  
 X 19 が G l n、A l a、G l u 又は L y s であり；  
 X 20 が G l n、L y s、A r g 又は H i s であり；  
 X 21 が A s p、A l a 又は G l u であり；  
 X 23 が V a l、I l e 又は L e u であり；  
 X 24 が A s n、G l u、A r g 又は L y s であり；  
 X 27 が L e u、G l u、V a l 又は I l e であり；  
 X 28 が A l a、S e r、A r g 又は A i b であり；  
 X 29 が G l n、G l y、A i b 又は A l a であり；  
 X 30 が L y s、G l y、P r o 又は存在せず；  
 X 31 が G l y、P r o、S e r、G l u 又は存在せず；  
 X 32 が L y s、S e r 又は存在せず；  
 X 33 が L y s、S e r、G l u 又は存在せず；  
 X 34 が A s n、G l y、A l a、L y s 又は存在せず；  
 X 35 が A s p、A l a、P r o、G l u 又は存在せず；  
 X 36 が T r p、P r o、L y s 又は存在せず；  
 X 37 が L y s、P r o、G l u 又は存在せず；  
 X 38 が H i s、P r o、S e r、L y s 又は存在せず；  
 X 39 が A s n、S e r 又は存在せず；  
 X 40 が I l e 又は存在せず；  
 X 41 が T h r 又は存在せず；

X 4 2 が G l n 又は存在せず；そして

R<sup>2</sup> が - N H<sub>2</sub> 又は - O H である]

により表される、請求項 1 に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 3】

一般式 ' :

R<sup>1</sup> - T y r - X 2 - G l u - G l y - T h r - P h e - X 7 - S e r - A s p - X 1 0  
- X 1 1 - X 1 2 - X 1 3 - L e u - X 1 5 - X 1 6 - L y s - A l a - X 1 9 - X 2 0  
- X 2 1 - P h e - X 2 3 - X 2 4 - T r p - L e u - X 2 7 - X 2 8 - X 2 9 - X 3 0  
- Y 1 - R<sup>2</sup> ( I I ' ) ( 配列番号 6 4 )

[ 式中、

R<sup>1</sup> が H y - 、 A c 又は p G l u であり；

X 2 が A i b 又は G l y であり；

X 7 が T h r 、 I l e 又は S e r であり；

X 1 0 が T y r 又は L e u であり；

X 1 1 が S e r 又は L e u であり；

X 1 2 が I l e 又は L y s であり；

X 1 3 が A l a 、 T y r 又は A i b であり；

X 1 5 が A s p 又は G l u であり；

X 1 6 が S e r 、 G l u 又は L y s であり；

X 1 7 が I l e 又は L y s であり；

X 1 9 が G l n 又は A l a であり；

X 2 0 が L y s 、 H i s 又は A r g であり；

X 2 1 が A l a 、 A s p 又は G l u であり；

X 2 3 が V a l 又は I l e であり；

X 2 4 が A s n 、 L y s 又は G l u であり；

X 2 7 が L e u 、 G l u 、 V a l 又は I l e であり；

X 2 8 が A i b 、 A l a 、 S e r 又は A r g であり；

X 2 9 が G l n 、 A i b 、 A l a 、 G l y 又は L y s であり；

X 3 0 が L y s 、 G l y 又は存在せず；

Y 1 が G l y - P r o - S e r - S e r - G l y - A l a - P r o - P r o - P r o - S e r 、 G l y - P r o - S e r - S e r - G l y - A l a - P r o - P r o - S e r 、 P r o - S e r - S e r - G l y - A l a - P r o - P r o - P r o - S e r 、 P r o - S e r - S e r - G l y - A l a - P r o - P r o - S e r 又は存在せず；そして

R<sup>2</sup> が - N H<sub>2</sub> 又は - O H である]

により表される、G I P アナログであって、

G I P 及び G L P - 1 受容体においてアゴニスト活性を有する前記アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 4】

前記 G I P アナログが、一般式 I I ( a ) ' :

R<sup>1</sup> - T y r - X 2 - G l u - G l y - T h r - P h e - X 7 - S e r - A s p - X 1 0  
- X 1 1 - I l e - X 1 3 - L e u - X 1 5 - X 1 6 - L y s - A l a - X 1 9 - X 2 0  
- X 2 1 - P h e - X 2 3 - X 2 4 - T r p - L e u - X 2 7 - X 2 8 - X 2 9 - X 3 0  
- Y 1 - R<sup>2</sup> ( I I ( a ) ' ) ( 配列番号 6 5 )

[ 式中、

R<sup>1</sup> が H y - 、 A c 又は p G l u であり；

X 2 が A i b 又は G l y であり；

X 7 が T h r 、 I l e 又は S e r であり；

X 1 0 が T y r 又は L e u であり；

X 1 1 が S e r 又は L e u であり；

X13がAla、Tyr又はAibであり；  
 X15がAsp又はGluであり；  
 X16がSer、Glu又はLysであり；  
 X19がGln、Lys、Ala又はGluであり；  
 X20がLys、His又はArgであり；  
 X21がAla、Asp又はGluであり；  
 X23がVal又はIleであり；  
 X24がAsn、Lys又はGluであり；  
 X27がLeu、Glu、Val又はIleであり；  
 X28がAib、Ala、Ser又はArgであり；  
 X29がGln、Aib、Ala又はGlyであり；  
 X30がLys、Gly又は存在せず；  
 Y1がGly-Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Pro-Ser、Gly-Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Ser、Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Pro-Ser、Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Ser又は存在せず；そして  
 $R^2$ が $-NH_2$ 又は $-OH$ である]  
 により表される、請求項3に記載のGIPアナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項5】

前記GIPアナログが、一般式II(b)′：

$R^1$ -Tyr-Aib-Glu-Gly-Thr-Phe-X7-Ser-Asp-Tyr-Ser-Ile-X13-Leu-X15-X16-Lys-Ala-Gln-X20-X21-Phe-X23-Glu-Trp-Leu-X27-X28-Ala-X30-Y1- $R^2$ (II(b)′)(配列番号66)

[式中、

$R^1$ がHy-、Ac又はpGluであり；  
 X7がThr又はSerであり；  
 X13がAla又はTyrであり；  
 X15がAsp又はGluであり；  
 X16がLys、Glu又はSerであり；  
 X20がLys、His又はArgであり；  
 X21がAla、Asp又はGluであり；  
 X23がVal又はIleであり；  
 X27がLeu、Glu又はValであり；  
 X28がArg又はSerであり；  
 X30がLys、Gly又は存在せず；  
 Y1がGly-Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Pro-Ser、Gly-Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Ser、Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Pro-Ser、Pro-Ser-Ser-Gly-Ala-Pro-Pro-Ser又は存在せず；そして  
 $R^2$ が $-NH_2$ 又は $-OH$ である]  
 により表される、請求項4に記載のGIPアナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項6】

前記GIPアナログが、一般式II(c)：

$R^1$ -Tyr-Aib-Glu-Gly-Thr-Phe-X7-Ser-Asp-Tyr-Ser-Ile-X13-Leu-X15-X16-Lys-Ala-Gln-X20-X21-Phe-Val-X24-Trp-Leu-X27-Ala-X29-X30-Y1- $R^2$ (II(c))(配列番号67)

[ 式中、

R<sup>1</sup> が Hy -、Ac 又は pGlu であり；

X<sub>7</sub> が Thr 又は Ser であり；

X<sub>13</sub> が Ala、Aib 又は Tyr であり；

X<sub>15</sub> が Asp 又は Glu であり；

X<sub>16</sub> が Glu、Lys 又は Ser であり；

X<sub>20</sub> が Lys、His 又は Arg であり；

X<sub>21</sub> が Ala、Asp 又は Glu であり；

X<sub>24</sub> が Glu 又は Asn であり；

X<sub>27</sub> が Leu、Glu 又は Val であり；

X<sub>29</sub> が Gln 又は Aib であり；

X<sub>30</sub> が Lys、Gly 又は存在せず；

Y<sub>1</sub> が Gly - Pro - Ser - Ser - Gly - Ala - Pro - Pro - Pro - Ser、Gly - Pro - Ser - Ser - Gly - Ala - Pro - Pro - Ser、Pro - Ser - Ser - Gly - Ala - Pro - Pro - Pro - Ser、Pro - Ser - Ser - Gly - Ala - Pro - Pro - Ser 又は存在せず；そして

R<sup>2</sup> が -NH<sub>2</sub> 又は -OH である]

により表される、請求項 4 に記載の GIP アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 7】

前記 GIP アナログが、一般式 II (d)：

R<sup>1</sup> - Tyr - Aib - Glu - Gly - Thr - Phe - X<sub>7</sub> - Ser - Asp - Tyr - Ser - Ile - X<sub>13</sub> - Leu - X<sub>15</sub> - X<sub>16</sub> - Lys - Ala - Gln - X<sub>20</sub> - Ala - Phe - Val - Glu - Trp - Leu - X<sub>27</sub> - Ala - Gln - X<sub>30</sub> - Y<sub>1</sub> - R<sup>2</sup> (II (d)) (配列番号 68)

[ 式中、

R<sup>1</sup> が Hy -、Ac 又は pGlu であり；

X<sub>7</sub> が Thr 又は Ser であり；

X<sub>13</sub> が Ala、Aib 又は Tyr であり；

X<sub>15</sub> が Asp 又は Glu であり；

X<sub>16</sub> が Glu、Lys 又は Ser であり；

X<sub>20</sub> が Lys、His 又は Arg であり；

X<sub>27</sub> が Leu、Glu 又は Val であり；

X<sub>30</sub> が Lys、Gly 又は存在せず；

Y<sub>1</sub> が Gly - Pro - Ser - Ser - Gly - Ala - Pro - Pro - Pro - Ser、Gly - Pro - Ser - Ser - Gly - Ala - Pro - Pro - Ser、Pro - Ser - Ser - Gly - Ala - Pro - Pro - Pro - Ser、Pro - Ser - Ser - Gly - Ala - Pro - Pro - Ser 又は存在せず；そして

R<sup>2</sup> が -NH<sub>2</sub> 又は -OH である]

により表される、請求項 5 に記載の GIP アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 8】

前記アミノ酸配列 X<sub>1</sub> - X<sub>29</sub> が、以下の (i) ~ (iii) のいずれかに該当する：

(i) 配列 Y - Aib - EGTFTSDYSIYLDKKAQRA FVEWLLAQ (配列番号 70) と 6 アミノ酸以下の違いを有する；

(ii) 配列 Y - Aib - EGTFTSDYSIYLEKKAAKE FVEWLLSA (配列番号 71) と 6 アミノ酸以下の違いを有する；又は

(iii) 配列 Y - Aib - EGTFTSDYSIYLD EKKAAKE FIEWL ESA (配列番号 72) と 5 アミノ酸以下の違いを有する、

請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の GIP アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩

若しくは溶媒和物。

【請求項 9】

X 2 4 が G l u であり、そして / あるいは X 2 1 が A l a である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 10】

以下の (i) ~ (x) のいずれかに該当する：

(i) X 7 が T h r であり、そして X 1 4 が L e u である；

(ii) X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u であり、そして X 1 8 が A l a である；

(iii) X 2 が A i b であり、X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u である；

(iv) X 2 が A i b であり、X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u であり、X 1 3 及び / 又は X 2 9 が A i b である；

(v) X 2 が A i b であり、X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u であり、そして X 2 4 が G l u である；

(vi) X 2 が A i b であり、X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u であり、X 2 4 が G l u であり、そして X 2 9 が G l n である；

(vii) X 2 が A i b であり、X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u であり、X 2 1 が A l a であり、X 2 4 が G l u であり、そして X 2 9 が G l n である；

(viii) X 2 が A i b であり、X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u であり、X 2 4 が G l u であり、X 2 7 が L e u であり、そして X 2 8 が S e r である；

(ix) X 2 が A i b であり、X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u であり、X 2 4 が G l u であり、X 2 7 が G l u であり、そして X 2 8 が S e r である；又は

(x) X 2 が A i b であり、X 7 が T h r であり、X 1 4 が L e u であり、X 2 0 が H i s であり、X 2 4 が G l u であり、X 2 7 が L e u であり、そして X 2 8 が S e r である、

請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 11】

1 又は複数の位置 1 5、1 6、1 7、1 9、2 0、2 4、2 7、2 8 及び 3 0 に結合した親油性置換基を有する、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の G I P アナログ。

【請求項 12】

H y - Y - A i b - E G T F I S D Y S I Y L E K K A A K E F V N W L L A Q K - N H<sub>2</sub>；

H y - Y - A i b - E G T F T S D Y S I - A i b - L D K K A Q R A F V E W L L A Q G P S S G A P P P S - N H<sub>2</sub>；

H y - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H<sub>2</sub>；

p G l u - Y A E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H<sub>2</sub>；

H y - Y G E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H<sub>2</sub>；

H y - Y - A i b - E G T F S S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H<sub>2</sub>；

H y - Y - A i b - E G T F T S D L S I Y L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H<sub>2</sub>；

H y - Y - A i b - E G T F T S D Y L I Y L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H<sub>2</sub>；

H y - Y - A i b - E G T F T S D Y S I A L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H<sub>2</sub>；

H y - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y S D K K A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H<sub>2</sub>；

Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E K K A Q R A F V N W L L A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I A L E K K A Q R A F V N W L L A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D S K A Q R A F V N W L L A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D E K A Q R A F V N W L L A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D S K A K R A F V N W L L A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q K E F V N W L L A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V K W L L A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L V A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L K A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L L - A i b - K  
 - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A E K A F V N W L L A - A i b -  
 K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b -  
 G P S S G A P P P S - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A Q R A F V N W L L A - A i b -  
 G P S S G A P P S - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E K K A A K E F V N W L L A Q K - N H  
<sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K - K ( 15 - カルボキシ - ペンタデカ  
 ノイル - イソ G l u ) - A Q R A F V N W L L A - A i b - K - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I - A i b - L D K - K ( ヘキサデカノイル - イ  
 ソ G l u ) - A Q R A F V E W L L A Q G P S S G A P P P S - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K - K ( ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A Q R A F V E W L L A Q G P S S G A P P P S - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D E - K ( ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A K E F I E W L E S A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K - K ( ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A Q R A F V N W L L A - A i b - K P S S G A P P P S - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I A L D K - K ( ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A Q R A F V N W L V A - A i b - K P S S G A P P P S - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E - K K A A K D F V E W L L S A - N H  
<sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E - K K A A H D F V E W L L S A - N H  
<sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E K K A Q K E F V E W L L S A - N H <sub>2</sub>  
 ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D E K A A K D F V E W L L S A - N H <sub>2</sub>  
 ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E S K A A H D F V E W L L S A - N H <sub>2</sub>  
 ;



Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D K K A A H D F V E W L L S A - N H <sub>2</sub>  
 ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E K K A A K E F V E W L L S A - N H <sub>2</sub>  
 ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D S K A A H D F V E W L L R A - N H <sub>2</sub>  
 ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S K Y L D S - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A H D F V E W L L S A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E K - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A K E F V E W L L S A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D S - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A H D F V E W L L R A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D E - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A K D F V E W L E S A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S K Y L D E - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A K D F I E W L E S A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D E - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A K D F I E W L E S A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S K Y L D S - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A H D F V E W L L R A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D E - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A K D F V E W L L S A - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D S - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A H D F V E W L L S A G P S S G A P P P S - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L E K - K - (ヘキサデカノイル - イソ G S  
 u) - A A K E F V E W L L S A G P S S G A P P P S - N H <sub>2</sub> ;  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D S K A A H D F V E W L L S A G P S S  
 G A P P P S - N H <sub>2</sub> ; 又は  
 Hy - Y - A i b - E G T F T S D Y S I Y L D E - K (ヘキサデカノイル - イソ G l u  
 ) - A A H D F V E W L L S A - N H <sub>2</sub>

である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 13】

治療方法に使用のための、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 14】

担体との混合において、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物を含有する医薬組成物であって、

ここで、例えば、前記塩は医薬的に許容される酸付加塩である、前記医薬組成物。

【請求項 15】

注射又は注入による投与に適した液体として製剤化される、あるいは前記 G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物の緩徐放出を引き起すために製剤化される、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

胃及び / 又は腸関連疾患、あるいは代謝疾患又は障害を治療する方法に使用するための、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 17】

前記代謝疾患又は障害が、糖尿病、糖尿病関連疾患、肥満、又は肥満関連疾患である、請求項 16 に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物

°

## 【請求項 18】

以下の (i) ~ (iii) のいずれかに該当する：

(i) 前記糖尿病関連疾患が、インスリン抵抗性、グルコース不耐性、増大した空腹時グルコース、前糖尿病、1型糖尿病、2型糖尿病、妊娠糖尿病、高血圧、脂質異常症、又はこれらの組み合わせである、

(ii) 前記糖尿病関連疾患が、アテローム性動脈硬化、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；あるいはアテローム性脂質異常症、高脂血症、上昇した血圧、高血圧、プロトロンビン状態、炎症促進性状態、又はこれらの組み合わせに関連する、あるいは、

(iii) 前記肥満関連疾患が、肥満関連炎症、肥満関連胆嚢疾患、及び肥満に誘導される睡眠時無呼吸から選択される、

請求項 17 に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物

°

## 【請求項 19】

以下の (i) ~ (iii) のいずれかに該当する：

(i) 前記高脂血症が、高トリグリセリド、低 H D L コレステロール、高 L D L コレステロール、動脈壁へのプラークの蓄積、又はこれらの組み合わせから選択される、

(ii) 前記プロトロンビン状態が、血中における高いフィブリノーゲンレベル、及び血中における高いプラスミノーゲン活性化因子阻害剤 - 1 レベルから選択される、あるいは

°

(iii) 前記炎症促進性状態が、血中の上昇した C 反応性タンパク質レベルである、

請求項 18 に記載の G I P アナログ又はこれらの医薬的に許容される塩若しくは溶媒和物

°