

【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24年11月15日(2012.11.15)

【公表番号】特表2012-504619(P2012-504619A)

【公表日】平成24年2月23日(2012.2.23)

【年通号数】公開・登録公報2012-008

【出願番号】特願2011-530103(P2011-530103)

【国際特許分類】

C 07 K 14/575 (2006.01)
C 07 K 4/00 (2006.01)
A 61 K 38/27 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 3/04 (2006.01)
C 07 K 5/00 (2006.01)
C 07 K 7/00 (2006.01)
C 12 N 15/09 (2006.01)

【F I】

C 07 K 14/575 Z N A
C 07 K 4/00
A 61 K 37/36
A 61 P 3/10
A 61 P 3/04
C 07 K 5/00
C 07 K 7/00
C 12 N 15/00 A

【手続補正書】

【提出日】平成24年9月12日(2012.9.12)

【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

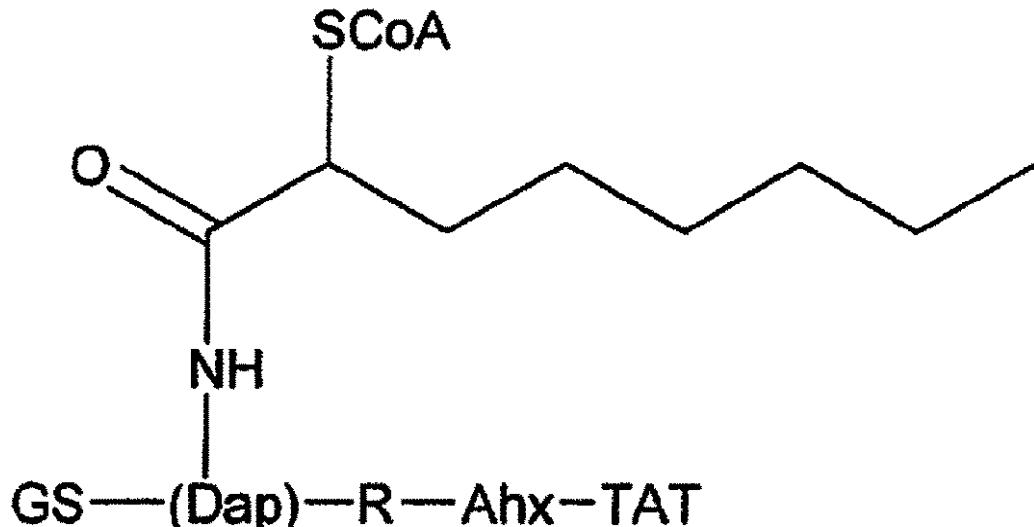
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物

【化1】



(式中、Rは存在しないか、あるいは置換または非置換のアルキル基、置換または非置換のペプチド鎖および置換または非置換の多糖からなる群から選択される有機部分である)。

【請求項2】

Rが1～12個のアミノ酸残基のペプチドである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Rがグレリン残基4から10までに対応する7個のアミノ酸残基のペプチドである、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

Rがグレリン残基4から15までに対応する12個のアミノ酸残基のペプチドである、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

Rがグレリン残基4から5までに対応する2個のアミノ酸残基のペプチドである、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

Rがグレリン残基4から28までに対応する25個のアミノ酸残基のペプチドである、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物および薬学的に許容される賦形剤または担体を含む組成物。

【請求項8】

請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物を調製する方法であって、3～5個のN末端アミノ酸残基を含むグレリンペプチド配列を提供する工程であって、3位のセリン残基がアロック保護1,2-ジアミノプロピオン酸に置換されており、D4-Tatがペプチド配列の一末端に結合している、工程と、

プロモオクタノイル化中間体を得るために、1または複数個の反応容器中で、グレリンペプチド配列を、Pd(PPh₃)₄パラジウム試薬、n-プロモオクタン酸無水物および試薬Kと一緒にする工程と、

前記プロモオクタノイル化中間体を補酵素Aと一緒にする工程とを含む方法。

【請求項9】

請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物の治療有効量を含む、対象での肥満治療のための医薬組成物。

【請求項 1 0】

前記医薬組成物の前記対象への投与が、該対象において除脂肪量よりも大きい脂肪量減少をもたらす、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 1】

前記医薬組成物の前記対象への投与が、該対象においてアシル - グレリンに対するグレリンの比の増加をもたらす、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記治療有効量が少なくとも約 5 m g / k g 対象の体重である、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

前記治療有効量が少なくとも約 1 5 m g / k g 対象の体重である、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

前記治療有効量が少なくとも約 2 5 m g / k g 対象の体重である、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 に記載の化合物の治療有効量を含む、対象での I I 型糖尿病の治療のための医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記医薬組成物の前記対象への投与が、該対象においてインスリン産生増加をもたらす、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

前記医薬組成物の前記対象への投与が、該対象においてグルコース曝露に対する応答性増加をもたらす、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記医薬組成物の前記対象への投与が、該対象において脱共役タンパク質 2 (U C P - 2) m R N A レベルの減少をもたらす、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

前記治療有効量が少なくとも約 5 m g / k g 対象の体重である、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

前記治療有効量が少なくとも約 1 5 m g / k g 対象の体重である、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

前記治療有効量が少なくとも約 2 5 m g / k g 対象の体重である、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

請求項 1 に記載の化合物の治療有効量を含む、対象での m B O A T 関連疾患の治療のための医薬組成物。

【請求項 2 3】

請求項 1 に記載の化合物の治療有効量を含む、対象での過敏性腸症候群の治療のための医薬組成物。

【請求項 2 4】

請求項 1 に記載の化合物の治療有効量の少なくとも 1 用量を含む組成物を含むキット。

【請求項 2 5】

さらなる体重減少治療薬の少なくとも 1 用量をさらに含む、請求項 2 4 に記載のキット。

【請求項 2 6】

前記対象がヒトである、請求項 9 ~ 2 3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。