

【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 1 部門第 1 区分

【発行日】平成23年9月29日(2011.9.29)

【公開番号】特開2011-103887(P2011-103887A)

【公開日】平成23年6月2日(2011.6.2)

【年通号数】公開・登録公報2011-022

【出願番号】特願2010-279920(P2010-279920)

【国際特許分類】

C 1 2 Q 1/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

G 0 1 N 33/50 (2006.01)

G 0 1 N 33/68 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【F I】

C 1 2 Q 1/02

A 6 1 K 45/00 Z N A

G 0 1 N 33/15 Z

G 0 1 N 33/50 Z

G 0 1 N 33/68

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 1 2 N 15/00 A

【手続補正書】

【提出日】平成23年8月8日(2011.8.8)

【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】

G I P 分泌促進薬の作用を有する G P R 1 1 9 アゴニストを含有する医薬組成物を調製する方法であって、以下の工程：

(a) 該 G P R 1 1 9 アゴニストをイン・ビトロにて脊椎動物腸内分泌細胞または G I P を分泌することができる細胞と接触させる工程；

(b) 該 G P R 1 1 9 アゴニストが該脊椎動物腸内分泌細胞から、または該 G I P を分泌することができる細胞からの G I P 分泌を刺激するか否かを決定する工程であって、該脊椎動物腸内分泌細胞から、または該 G I P を分泌することができる細胞からの G I P 分泌を刺激する該 G P R 1 1 9 アゴニストの能力が、該アゴニストが G I P 分泌促進薬であることを示す、工程；および

(c) 該 G I P 分泌促進薬の作用を有する G P R 1 1 9 アゴニストを、医薬上許容される担体とともに、医薬組成物として処方する工程を含む、方法。

【請求項 2】

G I P 分泌促進薬の作用を有する G P R 1 1 9 アゴニストを含有する医薬組成物を調製す

る方法であって、該 G P R 1 1 9 アゴニストは、イン・ビトロにて脊椎動物腸内分泌細胞または G I P を分泌することができる細胞と接触させられ、かつ該脊椎動物腸内分泌細胞から、または該 G I P を分泌することができる細胞からの G I P 分泌を刺激することが以前に決定されており、該脊椎動物腸内分泌細胞から、または該 G I P を分泌することができる細胞からの G I P 分泌を刺激する該 G P R 1 1 9 アゴニストの能力が、該アゴニストが G I P 分泌促進薬であることを示し、該方法は、

該 G I P 分泌促進薬の作用を有する G P R 1 1 9 アゴニストを、医薬上許容される担体とともに、医薬組成物として処方する工程を含む、方法。

【請求項 3】

前記腸内分泌細胞が K 細胞である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 4】

前記腸内分泌細胞が、小腸の K 細胞リッチな領域に由来する細胞である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 5】

前記腸内分泌細胞が、十二指腸組織由来の細胞である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 6】

前記腸内分泌細胞が、空腸組織由来の細胞である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 7】

前記脊椎動物腸内分泌細胞が、哺乳動物腸内分泌細胞である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 8】

前記腸内分泌細胞が、腸内分泌細胞系に由来する、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 9】

前記 G I P を分泌することができる細胞が、G I P を分泌できるように設計された組換え細胞である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 10】

前記 G I P を分泌することができる細胞が、膵臓細胞である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 11】

G I P 分泌促進薬の作用を有する G P R 1 1 9 アゴニストを含有する組成物を調製する方法であって、該方法は、

(a) 該 G P R 1 1 9 アゴニストを以前に投与された脊椎動物から得られた試料における G I P レベルを測定することによって、該 G P R 1 1 9 アゴニストが、脊椎動物における G I P レベルを増加させることを決定する工程；および

(b) 該 G P R 1 1 9 アゴニストを医薬上許容される担体とともに医薬組成物として処方する工程

を含む、方法。

【請求項 12】

G I P - 1 分泌促進薬の作用を有する G P R 1 1 9 アゴニストを含有する医薬組成物を調製する方法であって、該 G P R 1 1 9 アゴニストは、哺乳動物に投与されており、かつ、哺乳動物から得られた生物学的試料における血中 G I P レベルを増加させることが以前に決定されており、該生物学的試料における血中 G I P レベルを増加させる該 G P R 1 1 9 アゴニストの能力が、該アゴニストが G I P 分泌促進薬であることを示し、該方法は、

該 G I P 分泌促進薬の作用を有する G P R 1 1 9 アゴニストを、医薬上許容される担体とともに、医薬組成物として処方する工程を含む、方法。

【請求項 13】

前記脊椎動物が非ヒト哺乳動物である、請求項 1 1 または請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 14】

前記脊椎動物がヒトである、請求項 1 1 または請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 5】

前記生物学的試料が血液試料である、請求項 1 1 または請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 6】

前記生物学的試料が血漿試料である、請求項 1 1 または請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 7】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストがヒト G P R 1 1 9 のアゴニストである、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 1 8】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストが、小分子である、請求項 1 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 1 9】

前記小分子が、モル当たり 5 , 0 0 0 グラム未満の分子量を有する、請求項 1 8 に記載の方法。

【請求項 2 0】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストが、経口的に活性である、請求項 1 ~ 1 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 2 1】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは選択的 G P R 1 1 9 アゴニストである、請求項 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 2 2】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストが、コルチコトロピン放出因子 - 1 受容体に対する選択性を超える、G P R 1 1 9 に対する選択性を有する、請求項 2 1 に記載の方法。

【請求項 2 3】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは 1 0 μ M 未満の E C ₅₀ を有する、請求項 1 ~ 2 2 のいずれか 1 項記載の方法。

【請求項 2 4】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは 1 μ M 未満の E C ₅₀ を有する、請求項 1 ~ 2 2 のいずれか 1 項記載の方法。

【請求項 2 5】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは 1 0 0 n M 未満の E C ₅₀ を有する、請求項 1 ~ 2 2 のいずれか 1 項記載の方法。

【請求項 2 6】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストが、経口的に活性であり、かつ、1 0 0 n M 未満の E C ₅₀ を有する、請求項 1 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 2 7】

前記医薬組成物が投与形態である、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 2 8】

G I P 分泌促進薬を生産する方法であって、該方法は、

(a) G P R 1 1 9 アゴニストをイン・ビトロにて、脊椎動物腸内分泌細胞または G I P を分泌することができる細胞と接触させる工程；

(b) 該 G P R 1 1 9 アゴニストが、該脊椎動物腸内分泌細胞から、または該 G I P を分泌することができる細胞からの G I P 分泌を刺激することを決定する工程；および

(c) 該脊椎動物腸内分泌細胞から、または該 G I P を分泌することができる細胞からの G I P 分泌を刺激することが工程 (b) において決定された G P R 1 1 9 アゴニストの構造を決定する工程

を含む、方法。

【請求項 2 9】

G I P 分泌促進薬を生産する方法であって、該方法は、

(a) G P R 1 1 9 アゴニストを以前に投与された脊椎動物から得られた試料における G

IPレベルを測定することによって、該GPR119アゴニストが、脊椎動物におけるGIPレベルを増加させることを決定する工程；および

(c) GIPレベルを増加させることが工程(a)において決定されたGPR119アゴニストの構造を決定する工程を含む、方法。

【請求項30】

さらに、前記GIP分泌促進薬を生産または合成する工程を含む、請求項28または請求項29に記載の方法。

【請求項31】

前記GPR119アゴニストがヒトGPR119のアゴニストである、請求項28～30のいずれか1項に記載の方法。

【請求項32】

前記GPR119アゴニストが、経口的に活性である、請求項28～30のいずれか1項に記載の方法。

【請求項33】

前記GPR119アゴニストは選択的GPR119アゴニストである、請求項28～30のいずれか1項に記載の方法。

【請求項34】

前記GPR119アゴニストが、コルチコトロピン放出因子-1受容体に対する選択性を超える、GPR119に対する選択性を有する、請求項33に記載の方法。

【請求項35】

前記GPR119アゴニストは10 μ M未満のEC₅₀を有する、請求項28～34のいずれか1項記載の方法。

【請求項36】

前記GPR119アゴニストは1 μ M未満のEC₅₀を有する、請求項28～34のいずれか1項記載の方法。

【請求項37】

前記GPR119アゴニストは100 nM未満のEC₅₀を有する、請求項28～34のいずれか1項記載の方法。

【請求項38】

前記GPR119アゴニストが、小分子である、請求項28～37のいずれか1項に記載の方法。

【請求項39】

前記脊椎動物が非ヒト哺乳動物である、請求項29に記載の方法。

【請求項40】

前記脊椎動物がマウスである、請求項29に記載の方法。

【請求項41】

前記脊椎動物がヒトである、請求項30に記載の方法。

【請求項42】

さらに、前記GPR119分泌促進薬を医薬組成物として処方する工程を含む、請求項30に記載の方法。