

【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27年10月1日(2015.10.1)

【公表番号】特表2014-529629(P2014-529629A)

【公表日】平成26年11月13日(2014.11.13)

【年通号数】公開・登録公報2014-062

【出願番号】特願2014-528963(P2014-528963)

【国際特許分類】

C 07 K	14/605	(2006.01)
C 07 K	19/00	(2006.01)
A 61 K	38/22	(2006.01)
A 61 K	47/48	(2006.01)
A 61 K	47/42	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 P	1/14	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	15/08	(2006.01)
A 61 P	5/48	(2006.01)
A 61 P	3/06	(2006.01)

【F I】

C 07 K	14/605	Z N A
C 07 K	19/00	
A 61 K	37/24	
A 61 K	47/48	
A 61 K	47/42	
A 61 P	3/10	
A 61 P	1/14	
A 61 P	9/00	
A 61 P	1/04	
A 61 P	15/08	
A 61 P	5/48	
A 61 P	3/06	

【手続補正書】

【提出日】平成27年8月12日(2015.8.12)

【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】

GLP-1ペプチドの誘導体であつて、

ペプチドは、2つのみのLys残基、すなわち、第1および第2のLys残基、ならびにGLP-1(7-37)(配列番号3)と比較して最大で8個のアミノ酸の変化を有し、

誘導体は、リンカーを介して、それぞれ、前記第1および第2のLys残基のアミノ基に付着している2つの延長部分を含み、

前記延長部分は、Chem.15、およびChem.16:

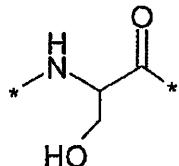
$$\text{Chem. 15: HOOCH}_2\text{-}(\text{CH}_2)_x\text{-CO-}^*$$

Chem. 16: HOOC-C₆H₄-O-(CH₂)_y-CO-

(式中、 x は、10～16の範囲の整数であり、 y は、8～12の範囲の整数である)から選択され

前記リンカーは、第1のリンカー要素、Chem.1:

【化 1】



を含む、誘導体、または前記誘導体の薬学的に許容される塩、アミド、もしくはエステル

6

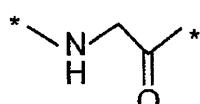
【請求項2】

前記リンカーが、2回のChem. 1を含む、請求項1に記載の誘導体。

【請求項 3】

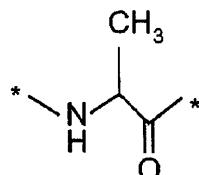
前記リンカ-が、第2のリンカ-要素、Chem.2:

【化2】



または、第3のリンカー要素、Chem.7:

〔化3〕

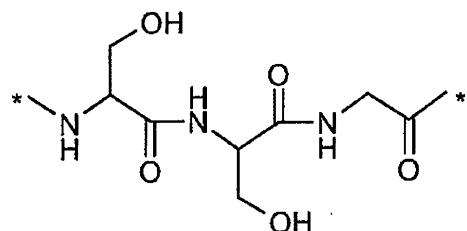


をさらに含む、請求項1から2のいずれか一項に記載の誘導体。

【請求項4】

前記リンクが、下記の通りの第1および第2のリンク要素の組合せ。Chem. 3:

【化 4】

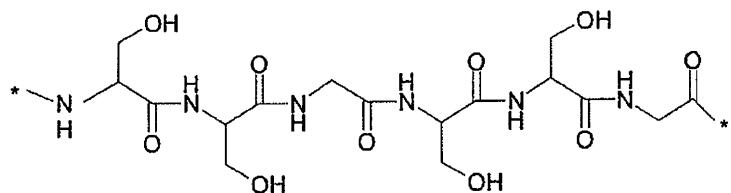


を含む、請求項1から3のいずれか一項に記載の誘導体。

【請求項 5】

前記リンクーが、下記の通りの第1および第2のリンクー要素の組合せ、Chem.4:

【化5】

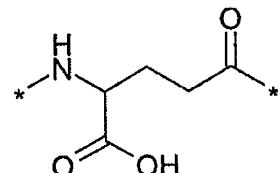


を含む、請求項1から4のいずれか一項に記載の誘導体。

【請求項6】

前記リンカーが、第4のリンカー要素、Chem.5:

【化6】

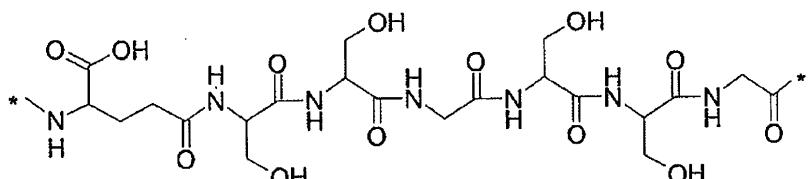


をさらに含む、請求項1から5のいずれか一項に記載の誘導体。

【請求項7】

前記リンカーが、Chem.6:

【化7】



を含む、請求項1から6のいずれか一項に記載の誘導体。

【請求項8】

前記リンカーが、第5のリンカー要素、Chem.12:

$^*-\text{NH}-(\text{CH}_2)_4-\text{CH}(\text{NH}_2)-\text{CO}-^*$

をさらに含む、請求項1から7のいずれか一項に記載の誘導体。

【請求項9】

前記GLP-1ペプチドが、式I

式I: Xaa₇-Xaa₈-Glu-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Xaa₁₆-Ser-Xaa₁₈-Xaa₁₉-Xaa₂₀-Glu-Xaa₂₂-Xaa₂₃-Ala-Xaa₂₅-Xaa₂₆-Xaa₂₇-Phe-Ile-Xaa₃₀-Xaa₃₁-Leu-Xaa₃₃-Xaa₃₄-Xaa₃₅-Xaa₃₆-Xaa₃₇-Xaa₃₈

のGLP-1ペプチドを含み、式中、

Xaa₇は、L-ヒスチジン、イミダゾプロピオニル、D-ヒドロキシ-ヒスチジン、D-ヒスチジン、デスマミノ-ヒスチジン、2-アミノ-ヒスチジン、D-ヒドロキシ-ヒスチジン、ホモヒスチジン、N-アセチル-ヒスチジン、N-ホルミル-ヒスチジン、D-フルオロメチル-ヒスチジン、D-メチル-ヒスチジン、3-ピリジルアラニン、2-ピリジルアラニン、または4-ピリジルアラニンであり、

Xaa₈は、Ala、Gly、Val、Leu、Ile、Thr、Ser、Lys、Aib、(1-アミノシクロプロピル)カルボン酸、(1-アミノシクロブチル)カルボン酸、(1-アミノシクロペンチル)カルボン酸、(1-アミノシクロヘキシリル)カルボン酸、(1-アミノシクロヘプチル)カルボン酸、または(1-アミノシクロオクチル)カルボン酸であり、

Xaa₁₆は、ValまたはLeuであり、

Xaa₁₈は、SerまたはLysであり、

Xaa₁₉は、TyrまたはGlnであり、

Xaa₂₀は、LeuまたはMetであり、
Xaa₂₂は、Gly、Glu、Lys、またはAibであり、
Xaa₂₃は、Gln、Glu、またはArgであり、
Xaa₂₅は、AlaまたはValであり、
Xaa₂₆は、Val、His、Lys、またはArgであり、
Xaa₂₇は、Glu、Leu、またはLysであり、
Xaa₃₀は、Ala、Glu、Lys、またはArgであり、
Xaa₃₁は、Trp、Lys、またはHisであり、
Xaa₃₃は、ValまたはLysであり、
Xaa₃₄は、Lys、Glu、Asn、Gly、Gln、His、Arg、または存在せず、
Xaa₃₅は、Gly、Aib、または存在せず、
Xaa₃₆は、Arg、Gly、Lys、または存在せず、
Xaa₃₇は、Gly、Ala、Glu、Pro、Lys、Arg、または存在せず、
Xaa₃₈は、Ser、Gly、Ala、Glu、Pro、Lys、Arg、または存在しない、請求項1から8のいずれかに記載の誘導体。

【請求項 1 0】

下記から選択される化合物:Chem.20、Chem.21、Chem.22、Chem.23、Chem.24、Chem.25、Chem.26、Chem.27、Chem.28、Chem.29、Chem.30、Chem.31、Chem.32、Chem.33、Chem.34、Chem.35、Chem.36、Chem.37、Chem.38、Chem.39、Chem.40、Chem.41、Chem.42、Chem.43、Chem.44、Chem.45、Chem.46、Chem.47、Chem.48、Chem.49、およびChem.50;またはその薬学的に許容される塩、アミド、もしくはエステル。

【請求項 1 1】

請求項1から10のいずれか一項に記載の誘導体、および薬学的に許容される添加剤を含む医薬組成物。

【請求項 1 2】

医薬として使用するための、請求項1から10のいずれかに記載の誘導体。

【請求項 1 3】

全ての形態の糖尿病および関連する疾患、摂食障害、心血管疾患、胃腸疾患、糖尿病性合併症、重篤疾患、および/もしくは多嚢胞性卵巣症候群の治療および/もしくは予防において使用するため、ならびに/または脂質パラメーターを改善するため、細胞機能を改善するため、ならびに/または糖尿病性疾患の進行を遅延もしくは予防するための、請求項1から10のいずれかに記載の誘導体。

【請求項 1 4】

全ての形態の糖尿病および関連する疾患、摂食障害、心血管疾患、胃腸疾患、糖尿病性合併症、重篤疾患、および/もしくは多嚢胞性卵巣症候群の治療および/もしくは予防のため、ならびに/または脂質パラメーターを改善するため、細胞機能を改善するため、ならびに/または糖尿病性疾患の進行を遅延もしくは予防するための医薬の製造における、請求項1から10のいずれかに記載の誘導体の使用。