

【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】令和6年1月25日(2024.1.25)

【国際公開番号】WO2021/150673

【公表番号】特表2023-511441(P2023-511441A)

【公表日】令和5年3月17日(2023.3.17)

【年通号数】公開公報(特許)2023-051

【出願番号】特願2022-544753(P2022-544753)

【国際特許分類】

C 0 7 K 1 4 / 6 0 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 8 / 2 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 4 7 / 5 4 (2 0 1 7 . 0 1)

C 1 2 N 1 5 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

10

20

【 F I 】

C 0 7 K 1 4 / 6 0 5 Z N A

A 6 1 P 3 / 1 0

A 6 1 P 3 / 0 6

A 6 1 P 3 / 0 4

A 6 1 P 3 / 0 0

A 6 1 P 1 / 1 6

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 K 3 8 / 2 2

A 6 1 K 4 7 / 5 4

C 1 2 N 1 5 / 1 2

30

【手続補正書】

【提出日】令和6年1月17日(2024.1.17)

【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】

40

【請求項1】

化合物：

X₁X₂E G T X₆T S D X₁₀X₁₁X₁₂X₁₃L D X₁₆X₁₇A Q X₂₀X₂₁X₂₂I X₂₄X₂₅L I X₂₈G X₃₀

(配列番号505)

(式中、

X₁が、YおよびR₁Yからなる群から選択され、

R₁が、N末端アミノ基のAc修飾であり、

X₂が、Aibであり、

X₆が、MeFおよびMeF(2F)からなる群から選択され、

50

X₁₀が、4Pal、Y、MeF、MeF(2F)、MeL、MeV、Ac4c、Ac5c、Ac6c、Bip、1Na1、2Na1、OMeY、hTyr、N1e、V、4CPhe、ChG、ChA、Bzt、2FA、4TAA、2TA、3TA、およびKZ₁からなる群から選択され、

X₁₁が、S、MeS、Aib、G、Dap、Ac5c、およびT1eからなる群から選択され、

X₁₂が、IおよびKZ₁からなる群から選択され、

X₁₃が、MeLおよびMeFからなる群から選択され、

X₁₆が、Ornであり、

X₁₇が、Q、I、およびKZ₁からなる群から選択され、

X₂₀が、Aib、Orn、4Pal、MeF、Ac5c、およびAc6cからなる群から選択され、

X₂₁が、E、KZ₁、G、Orn、および4Palからなる群から選択され、

X₂₂が、F、2ClPhe、3ClPhe、2FPhe、3FPhe、3,5FPhe、1Na1、2Na1、MeF(2F)、ChA、Bzt、およびMeFからなる群から選択され、

X₂₄が、D-Glu、E、G、およびKZ₁からなる群から選択され、

X₂₅が、Y、MeY、MeF、およびKZ₁からなる群から選択され、

X₂₈が、E、Orn、およびKZ₁からなる群から選択され、

X₃₀が、G、Orn、KZ₁、K(Z₁)R₆、OrnR₂、およびGR₂からなる群から選択され、

R₂が、X₃₁、X₃₁SSG(配列番号5)、X₃₁SSG-R₃(配列番号6)、X₃₁SSGX₃₅PPPX₃₉(配列番号7)、X₃₁SSGX₃₅PPPX₃₉R₃(配列番号8)、X₃₁SSGX₃₅PPPX₃₉X₄₀(配列番号9)、X₃₁SSGX₃₅PPPX₃₉X₄₀R₃(配列番号10)、およびc末端基の修飾からなる群から選択され、前記修飾が、NH₂であり、

R₆が、PSSG(配列番号506)、PSSG-R₃(配列番号507)、PSSGX₃₅PPPX₃₉(配列番号508)、PSSGX₃₅PPPX₃₉R₃(配列番号509)、PSSGX₃₅PPPX₃₉X₄₀(配列番号510)、PSSGX₃₅PPPX₃₉X₄₀R₃(配列番号511)、およびc末端基の修飾からなる群から選択され、前記修飾が、NH₂であり、

X₃₁が、PおよびKZ₁からなる群から選択され、

X₃₅が、AおよびOrnからなる群から選択され、

X₃₉が、SおよびOrnからなる群から選択され、

X₄₀が、KZ₁であり、

R₃が、C末端基の修飾であり、前記修飾が、NH₂であり、

X₁₀、X₁₂、X₁₇、X₂₁、X₂₄、X₂₅、X₂₈、X₃₀、X₃₁、およびX₄₀のうちの、2つ、および2つのみが、KZ₁もしくはK(Z₁)R₆であり、

Z₁が、R₅および-R₄R₅からなる群から選択され、

R₄が、リンカーであり、

R₅が、脂肪酸である)、または

その薬学的に許容される塩。

【請求項2】

X₃₀が、G、Orn、KZ₁、およびGR₂からなる群から選択され、

R₂が、X₃₁SSG(配列番号5)、X₃₁SSG-R₃(配列番号6)、X₃₁SSGX₃₅PPPX₃₉(配列番号7)、X₃₁SSGX₃₅PPPX₃₉R₃(配列番号8)、X₃₁SSGX₃₅PPPX₃₉X₄₀(配列番号9)、X₃₁SSGX₃₅PPPX₃₉X₄₀R₃(配列番号10)、およびc末端基の修飾からなる群から選択され、前記修飾が、NH₂である、請求項1に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

10

20

30

40

50

Z₁が、-R₄R₅である、請求項1または2に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

R₅が、-CO-(CH₂)₁₂-CO₂H、CO-(CH₂)₁₄-CO₂H、-CO-(CH₂)₁₀-CO₂H、-(10-(4-カルボキシフェノキシ)デカノイル)、-(4-(4-ヨードフェニル)ブタノイル)、-(4-(4-tert-ブチルフェニル)ブタノイル)、-CO-(CH₂)₁₄-CH₃、-CO-(CH₂)₁₂-CH₃、-CO-(CH₂)₁₀-CH₃、-(7-(4-カルボキシフェノキシ)ヘプタノイル)、-(11-(4-カルボキシフェノキシ)ウンデカノイル)、-(12-(4-カルボキシフェノキシ)ドデカノイル)、および-(8-(4-カルボキシフェノキシ)オクタノイル)からなる群から選択される、請求項1~3のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

10

【請求項5】

R₅が、
-CO-(CH₂)₁₂-CO₂H、-CO-(CH₂)₁₀-CO₂H、-(10-(4-カルボキシフェノキシ)デカノイル)、-(4-(4-ヨードフェニル)ブタノイル)、-(4-(4-tert-ブチルフェニル)ブタノイル)、-CO-(CH₂)₁₄-CH₃、-CO-(CH₂)₁₂-CH₃、-CO-(CH₂)₁₀-CH₃、-(7-(4-カルボキシフェノキシ)ヘプタノイル)、および-(8-(4-カルボキシフェノキシ)オクタノイル)からなる群から選択される、請求項1~4のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

20

【請求項6】

R₅が、
CO-(CH₂)₁₄-CO₂H、-(11-(4-カルボキシフェノキシ)ウンデカノイル)、および-(12-(4-カルボキシフェノキシ)ドデカノイル)からなる群から選択される、請求項1~4のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項7】

R₄が、-(K)_{a1}-(Glu)_{a2}-(2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)_{a3}-(K)_{b1}-(Glu)_{b2}であり、
a₁が、0、1、および2からなる群から選択され、
a₂が、0、1、および2からなる群から選択され、
a₃が、0、1、2、および3からなる群から選択され、
b₁が、0または1であり、
b₂が、0または1である、請求項1~6のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

30

【請求項8】

R₄が、
-(2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(Glu)₂ -、
-(2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂ -、
-(2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)-(Glu)₂ -、
-(2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(Glu)₂)₂ -、
-(2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₃-(Glu)₂ -、
-(2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(K) -、
-(2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(K)-(Glu) -、

40

50

- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (K) - (- G l u) - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - T r x - (- G l u) - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - T r x - (- G l u) - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - A o c - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - A o c - (- G l u) - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - A h x - (- G l u) - 、
 - P E G 3 - (- G l u) - 、
 - P E G 4 - (- G l u) - 、
 - P E G 5 - (- G l u) - 、
 - P E G 6 - (- G l u) - 、
 - A h x - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - 、
 - A o c - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - 、
 - (K) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - 、
 - (K) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - 、
 - (K) - (- G l u) - 、
 - (K) - (- G l u) - (- G l u) - 、
 - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - 、
 - (K) - (K) - (- G l u) - 、
 - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - 、
 - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - 、および
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) -
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - か
- らなる群から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

R₄ が、

- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - 、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - 、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
- 、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- G l u)

-) - 、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (K) - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (K) - (- G l u) - 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (K) - (- G l u) - 、
 - (K) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - 、
 - (K) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - 、
 - (K) - (- G l u) - 、
 - (K) - (- G l u) - (- G l u) - 、
 - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - 、
 - (K) - (K) - (- G l u) - 、
 - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - 、 および
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - からなる群から選
- 択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。 20
- 【請求項 10】
- Z₁ が、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - C O - (C H₂)₁₀ - C O₂ H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - (4 - (4 - ヨードフェニル) ブタノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - (4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) ブタノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - C O - (C H₂)₁₄ - C H₃、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - C O - (C H₂)₁₂ - C H₃、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)) - C O - (C H₂)₁₀ - C H₃、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)) - C O - (C H₂)₁₄ - C H₃、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u))
- 40 50

- CO - (CH₂)₁₀ - CH₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₄ - CH₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (K) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (K) - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (K) - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (K) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (K) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (K) - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (K) - (- Glu) - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (- Glu) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (K) - (K) - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (- Glu) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- Glu)
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu)
- (7 - (4 - カルボキシフェノキシ)ヘプタノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu)
- (8 - (4 - カルボキシフェノキシ)オクタノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- Glu)
- (4 - (4 - tert - ブチルフェニル)プタノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu)
- (11 - (4 - カルボキシフェノキシ)ウンデカノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- Glu)
- (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu)
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- Glu)
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- PEG₃ - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- PEG₄ - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- Glu)
- CO - (CH₂)₁₀ - CH₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu)
- (11 - (4 - カルボキシフェノキシ)ウンデカノイル、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu)
- CO - (CH₂)₁₄ - CO₂H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Ahx - (-

- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Aoc - (-
 Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - Ahx - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (-
 Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - Aoc - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (-
 Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Ahx - (-
 Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Aoc - (- 10
 Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - Ahx - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (-
 Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - Aoc - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (-
 Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - PEG4 - (- Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - PEG3 - (- Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Aoc - CO -
 (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - PEG6 - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、 20
 - PEG5 - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - PEG6 - (- Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - PEG5 - (- Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - Trx - (-
 - Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - Trx - (-
 - Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Trx - (-
 Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、 30
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Trx - (-
 Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu
)₂ - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu
)₂ - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - (- Glu) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)
 2 - (- Glu) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (- Glu) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)
 2 - (- Glu) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- Glu) 40
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- Glu) -
 CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、および
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- Glu)
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- Glu) -
 (10 - (4 - カルボキシフェノキシ)デカノイル)からなる群から選択される、請求項
 2、および4～9のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。
【請求項11】
 Z₁が、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- Glu
) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、 50

- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)
) - C O - (C H₂)₁₀ - C O₂ H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)
) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)
) - (4 - (4 - ヨードフェニル) ブタノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)
) - (4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) ブタノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)
) - C O - (C H₂)₁₄ - C H₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)
) - C O - (C H₂)₁₂ - C H₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u)
) - C O - (C H₂)₁₀ - C H₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (10 - (4 -
 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
 - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
 - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
 - C O - (C H₂)₁₄ - C H₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
 - C O - (C H₂)₁₀ - C H₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- G l u)
) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- G l u)
) - C O - (C H₂)₁₄ - C H₃、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (K) - C
 O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (K) - (-
 - G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (K) - (-
 - G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (K) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (-
 - G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (K) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (-
 - G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (K) - (- G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (K) - (- G l u) - (- G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)
)₂ - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (K) - (K) - (- G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)
) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H、
- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u)
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - C O - (C H₂)
)₁₂ - C O₂ H、

10

20

30

40

50

- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (7 - (4 - カルボキシフェノキシ) ヘプタノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (8 - (4 - カルボキシフェノキシ) オクタノイル)、および
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - (4 - (4 - tert - ブチルフェニル) ブタノイル) からなる群から選択される、請求項 10 に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 12】

Z₁ が、

- (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (11 - (4 - カルボキシフェノキシ) ウンデカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - PEG₃ - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - PEG₄ - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₃ - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₀ - CH₃、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (11 - (4 - カルボキシフェノキシ) ウンデカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₄ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Ahx - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Aoc - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - Ahx - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - Aoc - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Ahx - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Aoc - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - Ahx - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - Aoc - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - PEG₄ - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - PEG₃ - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - Aoc - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - PEG₆ - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - PEG₅ - (- G l u) - CO - (CH₂)₁₂ - CO₂H、
 - PEG₆ - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)、

- P E G 5 - (- G l u) - (1 0 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル) 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) 2 - T r x - (- G l u) - C O - (C H 2) 1 2 - C O 2 H 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) 2 - T r x - (- G l u) - (1 0 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル) 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - T r x - (- G l u) - C O - (C H 2) 1 2 - C O 2 H 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - T r x - (- G l u) - (1 0 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル) 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) 2 - (- G l u)) 2 - C O - (C H 2) 1 2 - C O 2 H 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) 2 - (- G l u)) 2 - (1 0 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル) 、
 - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) 2 - (- G l u) - C O - (C H 2) 1 2 - C O 2 H 、
 - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) 2 - (- G l u) - (1 0 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル) 、
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - C O - (C H 2) 1 2 - C O 2 H 、 および
 - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - (2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル) - (- G l u) - (1 0 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル) からなる群から選択される、請求項 1 0 に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 3】

X₁ が、 Y であり、
 X₆ が、 M e F (2 F) であり、
 X₁₀ が、 4 P a l 、 Y 、 および K Z₁ からなる群から選択され、
 X₁₁ が、 S 、 M e S 、 および A i b からなる群から選択され、
 X₁₂ が、 I であり、
 X₁₃ が、 M e L であり、
 X₁₆ が、 O r n であり、
 X₁₇ が、 I および K Z₁ からなる群から選択され、
 X₂₀ が、 A i b であり、
 X₂₁ が、 E または K Z₁ であり、
 X₂₂ が、 F および M e F からなる群から選択され、
 X₂₄ が、 D - G l u および K Z₁ からなる群から選択され、
 X₂₅ が、 M e Y であり、
 X₂₈ が、 E および K Z₁ からなる群から選択され、
 X₃₀ が、 G および G R₂ からなる群から選択され、
 R₂ が、 X₃₁ S S G X₃₅ P P P X₃₉ (配列番号 7) 、 X₃₁ S S G X₃₅ P P P X₃₉ R₃ (配列番号 8) 、 および X₃₁ S S G X₃₅ P P P X₃₉ X₄₀ (配列番号 9) 、
 ならびに c 末端基の修飾からなる群から選択され、前記修飾が、 N H₂ であり、
 またはその薬学的に許容される塩、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

X₃₀ が、 G R₂ であり、
 R₂ が、 X₃₁ S S G X₃₅ P P P X₃₉ (配列番号 7) 、 X₃₁ S S G X₃₅ P P P X₃₉ R₃ (配列番号 8) 、 および X₃₁ S S G X₃₅ P P P X₃₉ X₄₀ (配列番号 9) からなる群から選択される、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその

薬学的に許容される塩。

【請求項 15】

X₁₇ および X₃₁ が、各々 KZ₁ である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 16】

X₁₇ および X₂₄ が、各々 KZ₁ である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 17】

X₁₇ および X₂₁ が、各々 KZ₁ である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

10

【請求項 18】

X₁₇ および X₂₈ が、各々 KZ₁ である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 19】

X₂₁ および X₂₈ が、各々 KZ₁ である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 20】

X₂₄ および X₂₈ が、各々 KZ₁ である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 21】

X₁₇ および X₄₀ が、各々 KZ₁ である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

20

【請求項 22】

X₂₁ および X₄₀ が、各々 KZ₁ である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 23】

前記化合物が、

Y - A i b - E G T - M e F (2 F) - T S D - 4 P a l - S I - M e L - L D -
O r n - K ((2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H) A Q - A i b - E F I - (D - G l u)
- M e Y - L I E G G K ((2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - C O - (C H₂)₁₂ - C O₂ H) S S G A P P P S - N H₂、

30

Y - A i b - E G T - a M e F (2 F) - T S D - 4 P a l - S I - a M e L - L D -
O r n - K ((2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)) A Q - A i b - E F I - (D - G l u) - a M e Y - L I E G G K ((2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (10 - (4 - カルボキシフェノキシ) デカノイル)) S S G A P P P S - N H₂、

Y - A i b - E G T - a M e F (2 F) - T S D - 4 P a l - S I - a M e L - L D -
O r n - K ((2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (4 - (4 - ヨードフェニル) ブタノイル)) A Q - A i b - E F I - (D - G l u) - a M e Y - L I E G G K ((2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (4 - (4 - ヨードフェニル) ブタノイル)) S S G A P P P S - N H₂、

40

Y - A i b - E G T - a M e F (2 F) - T S D - 4 P a l - S I - a M e L - L D -
O r n - K ((2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (4 - (4 - tert - ブチルフェニル) ブタノイル)) A Q - A i b - E F I - (D - G l u) - a M e Y - L I E G G K ((2 - [2 - (2 - アミノ - エトキシ) - エトキシ] - アセチル)₂ - (- G l u) - (4 - (4 - tert - ブチルフェニル)) S S G A P P P S - N H₂、

50

ル)ブタノイル))SSGAPPPS-NH₂、および
 Y-Aib-EGT-MeF(2F)-TSD-4Pal-SI-MeL-LD-Orn-K((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-CO-(CH₂)₁₀-CH₃)AQ-Aib-EFI-(D-Glu)-
 MeY-LIEGGK((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-CO-(CH₂)₁₀-CH₃)SSGAPPPS-NH₂からなる群から選択される、請求項1に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩

【請求項24】

前記化合物が、Y-Aib-EGT-MeF(2F)-TSD-4Pal-SI-MeL-LD-Orn-K((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-CO-(CH₂)₁₀-CH₃)AQ-Aib-EFI-(D-Glu)-MeY-LIEGGK((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-CO-(CH₂)₁₀-CH₃)SSGAPPPS-NH₂である、請求項23に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

10

【請求項25】

前記化合物が、Y-Aib-EGT-aMeF(2F)-TSD-4Pal-SI-aMeL-LD-Orn-K((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-(4-(4-tert-ブチルフェニル)ブタノイル))AQ-Aib-EFI-(D-Glu)-aMeY-LIEGGK((2-[2-(2-ア
 ミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-(4-(4-tert-ブチルフェニル)ブタノイル))SSGAPPPS-NH₂である、請求項23に記載
 の、化合物、またはその薬学的に許容される塩。

20

【請求項26】

前記化合物が、Y-Aib-EGT-aMeF(2F)-TSD-4Pal-SI-aMeL-LD-Orn-K((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-(4-(4-ヨードフェニル)ブタノイル))AQ-Aib-EFI-(D-Glu)-aMeY-LIEGGK((2-[2-(2-アミノ-エト
 キシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-(4-(4-ヨードフェニル)ブ
 タノイル))SSGAPPPS-NH₂である、請求項23に記載の、化合物、またはそ
 の薬学的に許容される塩。

30

【請求項27】

前記化合物が、Y-Aib-EGT-aMeF(2F)-TSD-4Pal-SI-aMeL-LD-Orn-K((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-(10-(4-カルボキシフェノキシ)デカノイル))AQ-Aib-EFI-(D-Glu)-aMeY-LIEGGK((2-[2-(2-アミ
 ノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-(10-(4-カルボキ
 シフェノキシ)デカノイル))SSGAPPPS-NH₂である、請求項23に記載の、
 化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項28】

前記化合物が、Y-Aib-EGT-MeF(2F)-TSD-4Pal-SI-MeL-LD-Orn-K((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エトキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-CO-(CH₂)₁₂-CO₂H)AQ-Aib-EFI-(D-Glu)-MeY-LIEGGK((2-[2-(2-アミノ-エトキシ)-エ
 トキシ]-アセチル)₂-(
 -Glu)-CO-(CH₂)₁₂-CO₂H)SSGA
 P P P S - N H ₂である、請求項23に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される
 塩。

40

【請求項29】

請求項1~28のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩を
 含む、医薬組成物。

50

【請求項 30】

請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩と、少なくとも 1 つの薬学的に許容される担体、希釈剤、または賦形剤と、を含む、医薬組成物。

【請求項 31】

2 型糖尿病、肥満症、N A F L D、非アルコール性脂肪性肝炎、脂質異常症、およびメタボリックシンドロームからなる群から選択される状態を治療するための、請求項 29 または 30 に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

肥満症を治療するための、請求項 29 または 30 に記載の医薬組成物。

10

【請求項 33】

治療的減量を提供するための、請求項 29 または 30 に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

2 型糖尿病を治療するための、請求項 29 または 30 に記載の医薬組成物。

【請求項 35】

前記組成物が、皮下注射として投与される、請求項 29 ~ 34 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 36】

前記組成物が、経口投与される、請求項 29 ~ 34 のいずれか一項に記載の医薬組成物

20

【請求項 37】

2 型糖尿病、肥満症、N A F L D、非アルコール性脂肪性肝炎、脂質異常症、およびメタボリックシンドロームからなる群から選択される状態を治療するための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩の使用。

【請求項 38】

2 型糖尿病を治療するための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の、化合物、またはその薬学的に許容される塩の使用。

30

40

50