

【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6月28日 (2012.6.28)

【公表番号】特表2011-525895(P2011-525895A)

【公表日】平成23年9月29日 (2011.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2011-039

【出願番号】特願2011-515386(P2011-515386)

【国際特許分類】

C 0 7 K 19/00 (2006.01)

C 0 7 K 14/575 (2006.01)

C 0 7 K 14/765 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 19/00 Z N A

C 0 7 K 14/575

C 0 7 K 14/765

A 6 1 K 37/02

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 43/00 1 0 7

【手続補正書】

【提出日】平成24年5月8日 (2012.5.8)

【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】

ハイブリッドペプチド誘導体であって、

ハイブリッドペプチドが、

アミリン (1-7) - [A r g 1 1 , A r g 1 8] s C T (8-27) - アミリン (33

－ 3 7) (配列番号： 5)

アミリン (2－7)－[A r g 1 1, A r g 1 8] s C T (8－2 7)－アミリン (3 3

－ 3 7) (配列番号： 6)

アミリン (1－8)－[A r g 1 1, A r g 1 8] s C T (9－2 7)－アミリン (3 3

－ 3 7) (配列番号： 7)

アミリン (2－8)－[A r g 1 1, A r g 1 8] s C T (9－2 7)－アミリン (3 3

－ 3 7) (配列番号： 8)

[H i s 1] アミリン (1－8)－[H i s 1 1, H i s 1 8, H i s 2 4] s C T (9－

2 7)－アミリン (3 3－3 7) (配列番号： 9)

からなる群から選択され、

アルブミン結合部位がハイブリッドペプチドに結合している誘導体。

【請求項 2】

アルブミン結合部位がハイブリッドペプチドにリンカーを介して結合している、請求項 1 に記載の誘導体。

【請求項 3】

アルブミン結合部位が N 末端アミノ酸及び／又は C 末端アミノ酸及び／又はハイブリッドペプチドの内部の 1 又は複数のアミノ酸に結合している、請求項 1 または 2 に記載の誘導体。

【請求項 4】

誘導体がハイブリッドペプチドの N 末端に結合している 1 から 1 2 の付加的なアミノ酸からなる N 末端伸長を含み、ここで、アルブミン結合部位が、所望によりリンカーを介して、付加的なアミノ酸の N 末端アミノ酸に結合している、請求項 1 から 3 の何れか一項に記載の誘導体。

【請求項 5】

アルブミン結合残基が親油性残基である、請求項 1 から 4 の何れか一項に記載の誘導体。

【請求項 6】

アルブミン結合残基が負電荷を帯び得る基を含んでなる、請求項 1 から 4 の何れか一項に記載の誘導体。

【請求項 7】

アルブミン結合残基がカルボン酸基を含んでなる、請求項 6 に記載の誘導体。

【請求項 8】

アルブミン結合残基が、s が 4 から 3 8 の整数、好ましくは 4 から 2 4 の整数である $\text{H O O C (C H}_2\text{)}_s \text{C O}^-$ を含んでなる基から選択され、より好ましくは、 $\text{H O O C (C H}_2\text{)}_{14} \text{C O}^-$ 、 $\text{H O O C (C H}_2\text{)}_{16} \text{C O}^-$ 、 $\text{H O O C (C H}_2\text{)}_{18} \text{C O}^-$ 、 $\text{H O O C (C H}_2\text{)}_{20} \text{C O}^-$ 及び $\text{H O O C (C H}_2\text{)}_{22} \text{C O}^-$ を含む群から選択されるアシル基である、請求項 6 または 7 に記載の誘導体。

【請求項 9】

アルブミン結合残基が、直鎖アルキル基、分岐アルキル基、 ω カルボン酸基を有する基、及び部分的又は完全に水素化されたシクロペンタノフェナントレン骨格からなる群から選択される、請求項 1 から 8 の何れか一項に記載の誘導体。

【請求項 10】

アルブミン結合残基が、所望によりリンカーを介して、リシン残基の ϵ アミノ基に結合している、請求項 1 から 9 の何れか一項に記載の誘導体。

【請求項 11】

請求項 1 から 10 の何れか一項に記載の誘導体を含む薬学的組成物、及び薬学的に許容可能な賦形剤。

【請求項 12】

医薬として使用するための、請求項 1 から 10 の何れか一項に記載の誘導体。

【請求項 13】

高血糖症、2型糖尿病、耐糖能異常、1型糖尿病、肥満、高血圧、X症候群、脂質異常症、認知障害、アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞、冠状動脈性心臓病及び他の心臓血管疾患、卒中、炎症性腸症候群、消化不良及び胃潰瘍の治療又は予防のための医薬として使用するための、請求項1から10の何れか一項に記載の誘導体。

【請求項14】

摂食量減少、β細胞アポトーシス減少、β細胞機能及びβ細胞量の増大、および／またはβ細胞のグルコース感受性回復のための医薬として使用するための請求項1から10の何れか一項に記載の誘導体。

【請求項15】

請求項1から10の何れか一項に記載の誘導体の活性量を検体に投与することを含む、高血糖症、2型糖尿病、耐糖能異常、1型糖尿病、肥満、高血圧、X症候群、脂質異常症、認知障害、アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞、冠状動脈性心臓病及び他の心臓血管疾患、卒中、炎症性腸症候群、消化不良及び胃潰瘍の治療又は予防のための方法。

【請求項16】

請求項1から10の何れか一項に記載の誘導体の活性量を検体に投与することを含む、摂食量減少、β細胞アポトーシス減少、β細胞機能及びβ細胞量の増大、および／またはβ細胞のグルコース感受性回復のための方法。