

청구범위

- [청구항 1] 지속형 결합체의 액상 제제로서, 상기 액상 제제는
 18 ~ 936 nmol/mL의 하기 화학식 1의 지속형 결합체;
 상기 액상 제제의 pH를 4.8 내지 6.5의 범위에서 유지하기 위한 분량의
 완충 물질;과
 1.0 ~ 20%(w/v)의 당알코올, 당, 또는 이들의 조합;을 포함하는 액상 제제:
 [화학식 1]
 X - La - F
 상기 화학식 1에서 X는 글루카곤 유도체 펩타이드이고;
 L은 링커이며;
 a는 0 또는 자연수이며, 다만 a가 2 이상일 때, 각각의 L은 서로
 독립적이고;
 F는, 면역글로불린 Fc 절편이며;
 -는 공유결합을 나타냄:
 [일반식 2]
 Y-Aib-QGTF-X7-SD-X10-S-X12-Y-L-X15-X16-X17-R-A-X20-X21-F-V-X2
 4-W-L-M-N-T-X30(일반식 2, 서열번호: 47)
 상기 일반식 2에서,
 X7은 트레오닌(T), 발린(V) 또는 시스테인(C)이고;
 X10은 티로신(Y) 또는 시스테인(C)이고;
 X12는 리신(K) 또는 시스테인(C)이고;
 X15는 아스파르트산(D), 또는 시스테인(C)이고;
 X16은 글루탐산(E) 또는 세린(S)이며;
 X17은 리신(K) 또는 아르기닌(R)이고;
 X20은 글루타민(Q) 또는 리신(K)이며;
 X21은 아스파르트산(D), 또는 글루탐산(E)이고;
 X24는 발린(V) 또는 글루타민(Q)이고;
 X30은 시스테인(C)이거나, 부존재함
 (단, 상기 일반식 2의 아미노산 서열이 서열번호 1 및 서열번호 12와
 동일한 경우는 제외함).
- [청구항 2] 제1항에 있어서, 상기 펩타이드는 서열번호 2 내지 11, 및 13 내지 45에서
 선택된 어느 하나의 아미노산 서열인 액상 제제.
- [청구항 3] 제1항에 있어서, 상기 펩타이드는 서열번호 13, 15 및 36 내지 44중에서
 선택된 어느 하나의 아미노산 서열인 액상 제제.
- [청구항 4] 제1항에 있어서, 상기 펩타이드는 서열번호 37인 액상 제제.
- [청구항 5] 제1항에 있어서, X는 그 C-말단이 아미드화되어 있는 액상 제제.
- [청구항 6] 제1항에 있어서, X는 시스테인의 황 원자를 통하여 연결되어 있는 액상

- 제제.
- [청구항 7] 제1항에 있어서, 상기 면역글로불린 Fc 절편은 IgG4 유래인 액상 제제.
- [청구항 8] 제1항에 있어서, F는 2개의 폴리펩타이드 사슬이 이황화결합으로 연결되어 있는 구조이며, 상기 두 사슬 중 한 사슬의 질소 원자를 통해서만 연결되어 있는 액상 제제.
- [청구항 9] 제1항 내지 제8항 중 어느 한 항에 있어서, F는 서열번호 51의 아미노산 서열의 단량체의 동종이량체인 액상 제제.
- [청구항 10] 제8항에 있어서, F는 그 N-말단 프롤린의 질소 원자를 통하여 연결되어 있는 액상 제제.
- [청구항 11] 제1항에 있어서, 상기 면역글로불린 Fc 절편과 X가 당쇄화되어 있지 않은 액상 제제.
- [청구항 12] 제1항에 있어서, 상기 L은 폴리에틸렌글리콜인 액상 제제.
- [청구항 13] 제1항에 있어서, 상기 L 내의 에틸렌글리콜 반복 단위 부위의 화학식량은 1 내지 100 kDa 범위에 있는 액상 제제.
- [청구항 14] 제1항에 있어서, 상기 완충물질은 구연산과 그 염, 아세트산과 그 염, 히스티딘과 그 염, 인산과 그 염 및 이들의 조합으로 이루어진 군에서 선택하는 액상 제제.
- [청구항 15] 제14항에 있어서, 상기 완충물질은 아세트산과 그 염인 액상 제제.
- [청구항 16] 제1항에 있어서, 상기 액상 제제의 pH는 4.8 내지 6.5인 액상 제제.
- [청구항 17] 제1항에 있어서, 상기 액상 제제의 pH는 4.8 내지 6.0인 액상 제제.
- [청구항 18] 제17항에 있어서, 상기 액상 제제의 pH는 4.8 내지 5.5인 액상 제제.
- [청구항 19] 제1항에 있어서, 상기 완충물질의 농도는 액상 제제의 pH를 4.8 내지 6.5의 범위에서 유지하기 위한 5 내지 100mM인 액상 제제.
- [청구항 20] 제1항에 있어서, 상기 당은 글루코스, 프럭토스, 갈락토스, 락토스, 말토스, 수크로스, 또는 이들의 조합인 액상 제제.
- [청구항 21] 제20항에 있어서, 상기 당은 수크로스인 액상 제제.
- [청구항 22] 제20항에 있어서, 상기 당은 3 내지 15%(w/v)의 농도로 존재하는, 액상 제제.
- [청구항 23] 제1항에 있어서, 상기 당알코올은 만니톨 및 소르비톨로 구성되는 군으로부터 선택되는 하나 이상인 액상 제제.
- [청구항 24] 제1항에 있어서, 상기 액상 제제는 비이온성 계면활성제 및 아미노산으로 이루어진 군에서 선택되는 하나 이상의 성분을 더 포함하는 액상 제제.
- [청구항 25] 제24항에 있어서, 상기 비이온성 계면활성제는 액상제제 내에 0.01 ~ 0.1%(w/v)의 농도인 액상 제제.
- [청구항 26] 제24항에 있어서, 상기 비이온성 계면활성제는 폴록사머, 폴리소르베이트, 또는 이들의 조합인 액상 제제.
- [청구항 27] 제26항에 있어서, 상기 비이온성 계면활성제는 폴록사머 188, 폴리소르베이트 20, 폴리소르베이트 40, 폴리소르베이트 60,

폴리소르베이트 80 및 이들의 조합으로 이루어진 군에서 선택하는 액상 제제.

[청구항 28] 제24항에 있어서, 상기 아미노산은 메티오닌, 아르기닌, 히스티딘, 글리신, 시스테인, 라이신 및 이들의 조합으로 이루어진 군에서 선택하는 안정화제를 더 포함하는 액상 제제.

[청구항 29] 제1항에 있어서, 상기 액상 제제는 등장화제를 포함하지 않는 액상 제제.

[청구항 30] 제1항 내지 제29항 중 어느 항에 있어서, 상기 액상 제제는 90 ~ 562 nmol/mL의 화학식 1의 펩타이드 결합체; 상기 액상 제제의 pH가 4.8 내지 5.5가 되도록 구연산과 그 염, 아세트산과 그 염, 히스티딘과 그 염, 인산과 그 염 및 이들의 조합 중에서 선택하는 5 ~ 25 mM의 완충 물질; 1 ~ 20%(w/v)의 당알코올, 당, 또는 이들의 조합; 및 폴록사머, 폴리소르베이트 또는 이들의 조합 중에서 선택하는 0.01 ~ 0.1%(w/v)의 비이온성 계면활성제;와 메티오닌, 아르기닌, 히스티딘, 글리신, 시스테인, 라이신 및 이들의 조합으로 이루어진 군에서 선택하는 0.01 ~ 1 mg/mL의 안정화제를 함유하는 액상 제제.

[청구항 31] 제1항 내지 제30항 중 어느 한 항에 있어서, 상기 액상 제제는 90 ~ 562 nmol/mL의 화학식 1의 펩타이드 결합체; 상기 액상 제제의 pH가 4.8 내지 5.5가 되도록 구연산과 그 염, 아세트산과 그 염, 히스티딘과 그 염, 인산과 그 염 및 이들의 조합 중에서 선택하는 5 ~ 25 mM의 완충 물질; 4 ~ 10%(w/v)의 당; 및 폴록사머, 폴리소르베이트 또는 이들의 조합 중에서 선택하는 0.01 ~ 0.1%(w/v)의 비이온성 계면활성제;와 메티오닌, 아르기닌, 히스티딘, 글리신, 시스테인, 라이신 및 이들의 조합으로 이루어진 군에서 선택하는 0.01 ~ 1 mg/mL의 안정화제를 함유하는 액상 제제.