(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2011 年 5 月 5 日(05.05.2011)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2011/052523 A1

(51) 国際特許分類:
C07K 14/605 (2006.01) *A61P 3/04* (2006.01)
A61K 38/26 (2006.01) *A61P 3/10* (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01) *A61P 9/00* (2006.01)
A61P 1/14 (2006.01) *A61P 9/10* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2010/068814

(22) 国際出願日: 2010 年 10 月 25 日(25.10.2010)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2009-249597 2009 年 10 月 30 日(30.10.2009) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大塚化学株式会社(OTSUKA CHEMICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5400021 大阪府大阪市中央区大手通り３丁目２番２７号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 梶原　康宏(KAJIHARA, Yasuhiro) [JP/JP]; 〒5600054 大阪府豊中市桜の町６－１１－２０シャインロータス３０２号 Osaka (JP). 辻　孝(TSUJI, Takashi) [JP/JP]; 〒2700111 千葉県流山市江戸川台東３－１９８ Chiba (JP). 南部　由利(NAMBU, Yuri) [JP/JP]; 〒7710093 徳島県徳島市川内町加賀須野４６３　大塚化学株式会社内 Tokushima (JP). 石井一之(ISHII, Kazuyuki) [JP/JP]; 〒7710093 徳島県徳島市川内町加賀須野４６３　大塚化学株式会社内 Tokushima (JP). 吉田　健太(YOSHIDA, Kenta) [JP/JP]; 〒7710093 徳島県徳島市川内町加賀須野４６３　大塚化学株式会社内 Tokushima (JP). 手塚　克成(TEZUKA, katsunari) [JP/JP]; 〒7710093 徳島県徳島市川内町加賀須野４６３　大塚化学株式会社内 Tokushima (JP).

(74) 代理人: 南条　雅裕，外(NANJO, Masahiro et al.); 〒1070052 東京都港区赤坂９－７－２－１４１６　東京ＡＣＴｉ国際特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）
— 明細書の別個の部分として表した配列リスト（規則 5.2(a)）

WO 2011/052523 A1

(54) **Title**: GLYCOSYLATED FORM OF ANTIGENIC GLP-1 ANALOGUE

(54) 発明の名称 : 抗原性ＧＬＰ－１アナログの糖鎖付加体

(57) **Abstract**: Disclosed is a GLP-1 analogue which is obtained by ameliorating a highly antigenic GLP-1 analogue so that the GLP-1 analogue has reduced antigenicity without being lowered in the blood glucose suppressing activity. Specifically disclosed is a glycosylated form of an antigenic GLP-1 analogue, which has GLP-1 activity and is obtained by substituting at least one amino acid of an antigenic GLP-1 analogue with a glycosylated amino acid.

(57) 要約:　【課題】本発明は、抗原性が高いＧＬＰ－１アナログを改良し、その血糖値抑制活性を低下させることなく、抗原性を低下させたＧＬＰ－１アナログを提供することを課題とする。　【解決手段】本発明は、抗原性ＧＬＰ－１アナログの少なくとも１個のアミノ酸が糖鎖付加アミノ酸で置換され、ＧＬＰ－１活性を有する、抗原性ＧＬＰ－１アナログの糖鎖付加体を提供する。