(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국

(43) 국제공개일
2014 년 7 월 10 일 (10.07.2014)

WIPO | PCT

(10) 국제공개번호
WO 2014/107035 A1

(51) 국제특허분류:
C07K 14/575 (2006.01) *A61P 3/10* (2006.01)

(21) 국제출원번호: PCT/KR2014/000025

(22) 국제출원일: 2014 년 1 월 3 일 (03.01.2014)

(25) 출원언어: 한국어

(26) 공개언어: 한국어

(30) 우선권정보:
10-2013-0000766 2013 년 1 월 3 일 (03.01.2013) KR
10-2014-0000031 2014 년 1 월 2 일 (02.01.2014) KR

(71) 출원인: **한미약품 주식회사 (HANMI PHARM. CO., LTD.)** [KR/KR]; 445-958 경기도 화성시 팔탄면 무하로 214, Gyeonggi-do (KR).

(72) 발명자: **정성엽 (JUNG, Sung Youb)**; 442-754 경기도 수원시 팔달구 권광로 373 109 동 105 호, Gyeonggi-do (KR). **황상연 (HWANG, Sang Youn)**; 445-769 경기도 화성시 병점 4 로 102 1004 동 701 호, Gyeonggi-do (KR). **최인영 (CHOI, In Young)**; 448-160 경기도 용인시 수지구 용구대로 2771 번길 70 105 동 1801 호, Gyeonggi-do (KR). **박성희 (PARK, Sung Hee)**; 463-959 경기도 성남시 분당구 판교원로 209 603 동 1804 호, Gyeonggi-do (KR). **권세창 (KWON, Se Chang)**; 135-506 서울시 강남구 선릉로 221 408 동 1804 호, Seoul (KR).

(74) 대리인: **손민 (SON, Min)**; 135-855 서울시 강남구 양재천로 163 STX R&D 센터 6 층 한얼국제특허사무소, Seoul (KR).

(81) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 권리의 보호를 위하여): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, 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, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, 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, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, 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) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 역내 권리의 보호를 위하여): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 유라시아 (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), 유럽 (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, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

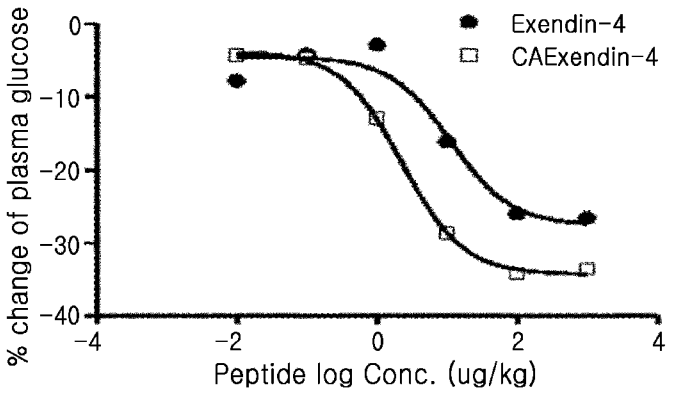
공개:

— 국제조사보고서와 함께 (조약 제 21 조(3))

[다음 쪽 계속]

(54) **Title**: INSULIN SECRETION PEPTIDE DERIVATIVE IN WHICH CHARGE ON N-TERMINUS IS MODIFIED

(54) **발명의 명칭** : N-말단 전하가 변형된 인슐린 분비 펩티드 유도체



* : $p < 0.05$

(57) **Abstract**: The present invention relates to an insulin secretion peptide derivative in which the charge on the N-terminus is modified and a pharmaceutical composition comprising the same, specifically, is characterized in that, in the insulin secretion peptide derivative, the positive charge on the N-terminus of an insulin secretion peptide is changed to a neutral charge or net negative charge in a neutral pH. The insulin secretion peptide derivative according to the present invention exhibits higher insulin secretion ability and blood glucose-reducing ability than natural insulin secretion peptides while maintaining the stability in the bloodstream because dissociation from a GLP-1 receptor rapidly progresses due to the change in the charge on the N-terminus, and thus is very useful in treating Type 2 diabetes.

(57) 요약서:

[다음 쪽 계속]

WO 2014/107035 A1

— 명세서의 서열목록 부분과 함께 (규칙 5.2(a))

본 발명은 N-말단 전하가 변형된 인슐린 분비 펩티드 유도체 및 이를 포함하는 약학적 조성물에 관한 것으로서, 구체적으로 상기 인슐린 분비 펩티드 유도체는 인슐린 분비 펩티드의 N-말단 양전하가 중성 pH 에서 중성 전하 또는 알짜 음전하로 변형된 것을 특징으로 한다. 본 발명에 따른 인슐린 분비 펩티드 유도체는 상기한 바와 같은 N-말단 전하의 변형으로 인해 GLP-1 수용체로부터의 해리가 신속히 진행되어 혈중 안정성을 유지하면서 천연형 인슐린 분비 펩티드에 비해 증가된 인슐린 분비능과 혈당 저하능을 나타내므로, 제 2 형 당뇨병 치료에 매우 유용하게 사용될 수 있다.