

【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 18 年 10 月 26 日 (2006.10.26)

【公表番号】特表 2005-519949 (P2005-519949A)

【公表日】平成 17 年 7 月 7 日 (2005.7.7)

【年通号数】公開・登録公報 2005-026

【出願番号】特願 2003-574615 (P2003-574615)

【国際特許分類】

C 07 C 233/63 (2006.01)

A 61 K 31/198 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 27/12 (2006.01)

C 07 C 215/10 (2006.01)

C 07 C 229/26 (2006.01)

【F I】

C 07 C 233/63

A 61 K 31/198

A 61 K 45/00

A 61 P 1/04

A 61 P 3/04

A 61 P 3/06

A 61 P 3/10

A 61 P 9/00

A 61 P 9/10

A 61 P 9/12

A 61 P 15/00

A 61 P 17/00

A 61 P 19/02

A 61 P 19/10

A 61 P 27/02

A 61 P 27/12

C 07 C 215/10

C 07 C 229/26

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 9 月 7 日 (2006.9.7)

【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】

50～300 の範囲の融点を有するナテグリニドの塩。

【請求項 2】

50～125 の範囲の融点を有する、請求項 1 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 3】

150～300 の範囲の融点を有する、請求項 1 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 4】

少なくとも 0.18 mg/ml の水溶性を有するナテグリニドの塩。

【請求項 5】

少なくとも 0.4 mg/ml の水溶性を有する、請求項 4 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 6】

少なくとも 40 mg/ml の水溶性を有する、請求項 5 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 7】

表 I V に示した反射極大値 (reflection maxima) の組合せを含む X 線粉末回折 (XRPD) パターンを有する、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 8】

アモルファスの形態で存在する、請求項 7 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 9】

結晶の形態で存在する、請求項 7 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 10】

アモルファスの形態および結晶の形態の混合物として存在する、請求項 7 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 11】

カチオンが、 Na^+ 、 K^+ 、 Ca^{2+} 、 Mg^{2+} 、トリス(ヒドロキシメチル)-アミノメタンのプロトン化された形態、N-メチル-D-グルカミンのプロトン化された形態およびリジンのプロトン化された形態からなる群から選択される、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 12】

ナテグリニドアニオンとカチオンの比が 1：1 である、請求項 11 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 13】

ナテグリニドアニオンとカチオンの比が 2：1 である、請求項 11 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 14】

加熱すると重量の 0.1～14% を失う、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 15】

加熱すると重量の 0.1～9% を失う、請求項 14 に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 16】

0.1～0.6 g/cm³ のバルク密度 (bulk density) を有する、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載のナテグリニドの塩。

【請求項 17】

請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載のナテグリニドの塩を含んでなる、組成物。

【請求項 18】

ビタミン、栄養補強品および医薬活性物質からなる群から選択される 1 またはそれ以上

の追加的成分を含んでなる請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 19】

追加的成分としてナテグリニドまたはレパグリニドを含んでなる請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 20】

医薬活性物質が、インスリン増感剤、インスリン分泌促進剤、ジペプチジルペプチダーゼⅠⅤインヒビター、ACEインヒビターおよびアンギオテンシンⅠⅠインヒビターからなる群から選択される、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 21】

組合せ調製物または医薬組成物である、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 22】

糖尿病、心血管疾患、またはそれらに伴う病状を処置するための、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

糖尿病、心血管疾患、またはそれらに伴う病状の処置のための、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載のナテグリニドの塩の使用。

【請求項 24】

心血管疾患またはそれらに伴う病状が、高血糖、高インスリン血症、高脂血症、インスリン抵抗症、グルコース代謝障害、肥満、糖尿病性網膜症、黄斑変性症、白内障、糖尿病性ネフロパシー、糸球体硬化症、糖尿病性ニューロパシー、勃起障害、月経前症候群、血管再狭窄、潰瘍性大腸炎、冠状動脈性心臓病、高血圧、狭心症、心筋梗塞、卒中、皮膚および結合組織障害、下肢潰瘍、代謝性アシドーシス、関節炎、骨粗鬆症、多嚢胞性卵巣症候群（PCOS）および耐糖能異常からなる群から選択される、請求項 23 に記載の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0066

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0066】

同時的、個別的または逐次的に使用するための、1 種またはそれ以上のナテグリニドの塩および少なくとも 1 種の他の成分および所望により少なくとも 1 種、すなわち、1 種またはそれ以上、たとえば 2 種の、医薬上許容される担体を含んでなる医薬調製物は、とりわけナテグリニドの塩またはナテグリニドの塩の組合せおよび 1 種またはそれ以上のさらなる医薬活性成分が、独立して投与され得る、あるいは異なる時点または同時的に個別量の成分を含む異なる所定の組合せ剤の使用により投与され得るという意味で「パーツのキット（kit of parts）」である。そして「パーツのキット」のパーツは、たとえば、同時に、または時間をずらして、つまり「パーツのキット」のいずれかのパーツについて異なる時点で、等しいまたは異なる時間間隔で投与され得る。好ましくは、この時間間隔は、各パーツの組合せ使用において処置される疾患または病状に対する効果がこれらの成分のいずれか 1 つのみを用いる場合に得られる効果よりも大きくなるように選択される。好ましくは、少なくとも 1 つの有利な効果、たとえばナテグリニドの 1 種またはそれ以上の塩および少なくとも 1 つのさらなる医薬活性成分の効果の相互増強、付加的な有利な効果、副作用の減少、別の方法、たとえば単剤療法においては非有効用量の 1 つまたはそれぞれの成分の併用治療効果、とりわけ当該物質と、組合せに関して本明細書において開示した化合物との間の相乗効果、たとえば相加効果を超える効果が存在する。