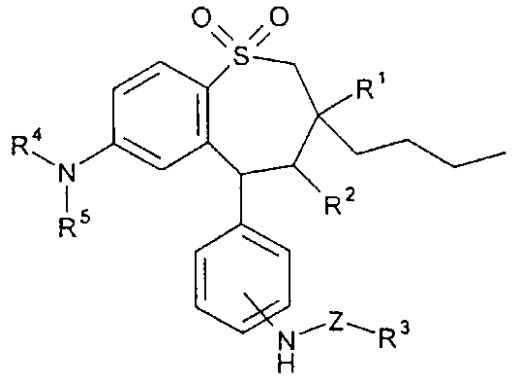
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-501861(P2005-501861A)
【公表日】平成17年1月20日(2005.1.20)
【年通号数】公開・登録公報2005-003
【出願番号】特願2003-522542(P2003-522542)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/38　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　45/00　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　 3/06　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　 9/10　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 337/08　　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/38
Ａ６１Ｋ　45/00
Ａ６１Ｐ　 3/06
Ａ６１Ｐ　 9/10　　１０１
Ａ６１Ｐ　43/00　　１２１
Ｃ０７Ｄ 337/08

【手続補正書】
【提出日】平成17年8月4日(2005.8.4)
【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】
式Ｉ
【化１】



Ｉ

〔式中、
R^1はメチル、エチル、プロピル、ブチルであり、
R^2はＨ、ＯＨ、NH_2、ＮＨ－（C_1－C_6）－アルキルであり、
R^3はサッカリド残基、ジサッカリド残基、トリサッカリド残基、テトラサッカリド残基（ここで該サッカリド残基、ジサッカリド残基、トリサッカリド残基又はテトラサッカ

リド残基は場合により一回又は複数回サッカリド保護基により置換される）；アミノ酸残基、ジアミノ酸残基、トリアミノ酸残基、テトラアミノ酸残基（ここで該アミノ酸残基、ジアミノ酸残基、トリアミノ酸残基又はテトラアミノ酸残基は場合により一回又は複数回アミノ酸保護基により置換される）であり、
R^4はメチル、エチル、プロピル、ブチルであり、
R^5はメチル、エチル、プロピル、ブチルであり、
Ｚは－(Ｃ＝Ｏ)$_n$－C_0－C_{16}－アルキル、－(Ｃ＝Ｏ)$_n$－C_0－C_{16}－アルキル－ＮＨ－、－(Ｃ＝Ｏ)$_n$－C_0－C_{16}－アルキル－Ｏ－、－(Ｃ＝Ｏ)$_n$－C_1－C_{16}－アルキル－(Ｃ＝Ｏ)$_m$又は共有結合であり、
ｎは０又は１であり、
ｍは０又は１である〕
で表される化合物、それらの薬学的に許容できる塩又は生理的に機能性の誘導体、及び他の活性成分からなる組成物。
【請求項２】
式Ｉにおいて、
R^1はエチル、プロピル、ブチルであり、
R^2はＨ、ＯＨ、NH_2、ＮＨ－（C_1－C_6）－アルキルであり、
R^3はサッカリド残基、ジサッカリド残基（ここで該サッカリド残基又はジサッカリド残基は場合により一回又は複数回サッカリド保護基により置換される）；アミノ酸残基、ジアミノ酸残基（ここで該アミノ酸残基又はジアミノ酸残基は場合により一回又は複数回アミノ酸保護基により置換される）であり、
R^4はメチル、エチル、プロピル、ブチルであり、
R^5はメチル、エチル、プロピル、ブチルであり、
Ｚは－(Ｃ＝Ｏ)$_n$－C_0－C_{16}－アルキル、－(Ｃ＝Ｏ)$_n$－C_0－C_{16}－アルキル－ＮＨ－、－(Ｃ＝Ｏ)$_n$－C_0－C_{16}－アルキル－Ｏ－、－(Ｃ＝Ｏ)$_n$－C_1－C_{16}－アルキル－(Ｃ＝Ｏ)$_m$又は共有結合であり、
ｎは０又は１であり、そして
ｍは０又は１である、式Ｉの化合物又はそれらの生理的に許容される酸付加塩である請求項１に記載の組成物。
【請求項３】
式Ｉの化合物において、
R^1はエチルであり、
R^2はＯＨであり、
R^3はサッカリド残基（ここで該サッカリド残基は場合により一回又は複数回サッカリド保護基により置換される）；ジアミノ酸残基（ここで該ジアミノ酸残基は場合により一回又は複数回アミノ酸保護基により置換される）であり、
R^4はメチルであり、
R^5はメチルであり、
Ｚは－(Ｃ＝Ｏ)－C_0－C_4－アルキル又は共有結合である、式Ｉの化合物又はそれらの生理的に許容される酸付加塩である請求項１又は２に記載の組成物。
【請求項４】
他の活性成分として一つ又はそれ以上の抗糖尿病薬、血糖降下活性成分、ＨＭＧ－ＣｏＡ還元酵素阻害剤、コレステロール吸収阻害剤、ＰＰＡＲガンマ作動薬、ＰＰＡＲアルファ作動薬、ＰＰＡＲアルファ／ガンマ作動薬、フィブラート、ＭＴＰ阻害剤、胆汁酸吸収阻害剤、ＣＥＴＰ阻害剤、ポリマー胆汁酸吸着剤、ＬＤＬ受容体誘導物質、ＡＣＡＴ阻害剤、抗酸化剤、リポタンパク質リパーゼ阻害剤、ＡＴＰ－シトレートリアーゼ阻害剤、スクアレン合成酵素阻害剤、リポタンパク質(ａ)拮抗薬、リパーゼ阻害剤、インスリン、スルホニル尿素、ビグアニド、メグリチニド、チアゾリジンジオン、α－グルコシダーゼ阻害剤、ベータ細胞のＡＴＰ依存性カリウムチャンネルに作用する活性成分、ＣＡＲＴ作動薬、ＮＰＹ作動薬、ＭＣ４作動薬、オレキシン作動薬、Ｈ３作動薬、ＴＮＦ作動薬、ＣＲ

Ｆ作動薬、ＣＲＦ ＢＰ拮抗薬、ウロコルチン作動薬、β３作動薬、ＭＳＨ（メラニン細胞刺激ホルモン）作動薬、ＣＣＫ作動薬、セロトニン再取込み阻害剤、混合セロトニン作動性及びノルアドレナリン作動性化合物、５ＨＴ作動薬、ボンベシン作動薬、ガラニン拮抗薬、成長ホルモン、成長ホルモン放出化合物、ＴＲＨ作動薬、脱共役タンパク質２又は３モジュレーター、レプチン作動薬、ＤＡ作動薬（ブロモクリプチン、ドプレキシン）、リパーゼ／アミラーゼ阻害剤、ＰＰＡＲモジュレーター、ＲＸＲモジュレーター又はＴＲ－β作動薬又はアンフェタミンを含む請求項１～３のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項５】

他の活性成分として脂質代謝を正常にする一つ又はそれ以上の化合物を含む請求項１～４のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項６】

脂質代謝を正常にする他の活性成分としてスタチン、グリタゾン、ＰＰＡＲアルファ作動薬、コレスチラミン、コレスチポル、コレソルバム、吸着性樹脂、フィブラート、ゲムフィブロジル、コレステロール吸収阻害剤、エゼチミベ、チクエシド、パマクエシド、ＣＥＴＰ阻害剤、ＭＴＰ阻害剤、ＬＤＬ受容体誘導物質、リパーゼ阻害剤、オルリスタットの群からの化合物を含む請求項１～５のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項７】

他の活性成分としてコレステロール吸収阻害剤を含む請求項１～６のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項８】

他の活性成分としてエゼチミベ、チクエシド又はパマクエシドを含む請求項７に記載の組成物。

【請求項９】

他の活性成分としてカロマックス(R)を含む請求項１～６のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項１０】

脂質代謝障害又は代謝症候群の予防又は治療用医薬としての請求項１～９のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項１１】

高脂質血症の予防又は治療用医薬としての請求項１～９のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項１２】

動脈硬化性症状の予防又は治療用医薬としての請求項１～９のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項１３】

式Ｉの化合物及び少なくとも一つの他の活性成分を、接近した時間内、好ましくは１０分以内に投与することを特徴とする請求項１～３のいずれか一項に記載の式Ｉの化合物及び少なくとも一つの他の活性成分との組み合わせからなる組成物。

【請求項１４】

式Ｉの化合物及び少なくとも一つの他の活性成分を、接近した時間内、好ましくは１０分以内に投与することを特徴とする請求項１～３のいずれか一項に記載の式Ｉの化合物及び脂質代謝障害の予防又は治療のための薬物としての少なくとも一つの他の活性成分との組み合わせからなる組成物。

【請求項１５】

活性成分を薬学的に適当な担体と混合し、そしてこの混合物を投与に適当な形態にすることからなる請求項１～８のいずれか一項に記載の組成物を製造する方法。