

【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30年3月8日(2018.3.8)

【公表番号】特表2017-504649(P2017-504649A)

【公表日】平成29年2月9日(2017.2.9)

【年通号数】公開・登録公報2017-006

【出願番号】特願2016-549388(P2016-549388)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7042 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 K 38/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/401 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7042

A 6 1 P 13/12

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 K 37/64

A 6 1 K 31/401

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 31/41

A 6 1 P 1/16

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/427

A 6 1 K 31/426

【手続補正書】

【提出日】平成30年1月29日(2018.1.29)

【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】**

(a) カナグリフロジン及び (b) 1 種若しくは 2 種以上の ACE 阻害剤又は 1 種若しくは 2 種以上の ARB と、医薬的に許容される担体と、を含む、医薬組成物。

【請求項 2】

前記カナグリフロジンが、結晶性半水和物として存在する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記カナグリフロジンが、約 50 ～ 約 500 mg の範囲の量である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記カナグリフロジンが、約 100 ～ 約 300 mg の範囲の量である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記 ACE 阻害剤が、ベナゼプリル、カプトプリル、エナラプリル、イミダプリル、リシノプリル及びラミプリルからなる群から選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記 ACE 阻害剤が、エナラプリル、イミダプリル、リシノプリル及びラミプリルからなる群から選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記 ARB が、カンデサルタン、イルベサルタン、ロサルタン及びバルサルタンからなる群から選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記 ARB が、イルベサルタン及びロサルタンからなる群から選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

腎障害の治療又は予防に有用である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

微量アルブミン尿症（尿アルブミンレベルの上昇）の治療に有用である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

尿アルブミンレベルの減少に有用である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

過剰濾過性糖尿病性腎症、腎過剰濾過、糸球体過剰濾過、同種移植腎過剰濾過、代償性過剰濾過、過剰濾過性慢性腎疾患、過剰濾過性急性腎不全、及び肥満からなる群から選択される病態又は障害の治療又は予防に有用である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

脂肪性肝障害の治療又は予防に有用である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記脂肪性肝障害が、アルコール性単純性脂肪肝、アルコール性脂肪性肝炎（ASH）、アルコール性肝線維症、アルコール性肝硬変、非アルコール性脂肪性肝疾患（NAFLD）、非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）、非アルコール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記脂肪性肝障害が、非アルコール性脂肪性肝疾患（NAFLD）、非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）、非アルコール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記脂肪性肝障害が、NAFLD 及び NASH からなる群から選択される、請求項 13

に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

(a) カナグリフロジン及び

(b) 1種若しくは2種以上の PPAR 作動薬と、医薬的に許容される担体と、
を含み、脂肪性肝障害の治療又は予防に有用である、医薬組成物。

【請求項 18】

前記脂肪性肝障害が、アルコール性単純性脂肪肝、アルコール性脂肪性肝炎 (ASH)、
アルコール性肝線維症、アルコール性肝硬変、非アルコール性脂肪性肝疾患 (NAFLD)、
非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH)、非アルコ
ール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、請求項 17 に記
載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記脂肪性肝障害が、非アルコール性脂肪性肝疾患 (NAFLD)、非アルコール性単
純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH)、非アルコール性肝線維症、及び非
アルコール性肝硬変からなる群から選択される、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

前記脂肪性肝障害が、NAFLD 及び NASH からなる群から選択される、請求項 17
に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

前記カナグリフロジンが、結晶性半水和物として存在する、請求項 17 に記載の医薬組
成物。

【請求項 22】

前記カナグリフロジンが、約 50 ~ 約 500 mg の範囲の量である、請求項 17 に記載
の医薬組成物。

【請求項 23】

前記カナグリフロジンが、約 100 ~ 約 300 mg の範囲の量である、請求項 17 に記
載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記 PPAR 作動薬が、ピオグリタゾン、リボグリタゾン、ロシグリタゾン、トログ
リタゾン、ネトグリタゾン及びシグリタゾンからなる群から選択される、請求項 17 に記
載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記 PPAR 作動薬が、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン及びトログリタゾンからな
る群から選択される、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0157

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0157】

前述の明細書は、例示を目的として提供される実施例と共に、本発明の原理を教示する
が、本発明の実践は、以下の特許請求の範囲及びそれらの均等物の範囲内に含まれる全て
の通常の変形、改作及び / 又は修正を包含することが理解されるであろう。

本発明は、以下の態様を含む。

[1]

(a) カナグリフロジン及び

(b) 1種若しくは2種以上の ACE 阻害剤又は1種若しくは2種以上の ARB を含む
治療上有効量の組合せ治療剤を、それを必要とする対象に投与することを含む、腎障害の

治療又は予防方法。

[2]

(a) カナグリフロジン及び (b) 1 種若しくは 2 種以上の A C E 阻害剤又は 1 種若しくは 2 種以上の A R B の組み合わせを含むか、その組み合わせからなるか又はその組み合わせから本質的になる治療上有効量の組合せ治療剤を、それを必要とする対象に投与することを含む、微量アルブミン尿症 (尿アルブミンレベルの上昇) の治療方法。

[3]

(a) カナグリフロジン及び (b) 1 種若しくは 2 種以上の A C E 阻害剤又は 1 種若しくは 2 種以上の A R B の組み合わせを含むか、その組み合わせからなるか又はその組み合わせから本質的になる治療上有効量の組合せ治療剤を、それを必要とする対象に投与することを含む、尿アルブミンレベルの減少方法。

[4]

(a) カナグリフロジン及び (b) 1 種若しくは 2 種以上の A C E 阻害剤又は 1 種若しくは 2 種以上の A R B の組み合わせを含むか、その組み合わせからなるか又はその組み合わせから本質的になる治療上有効量の組合せ治療剤を、それを必要とする対象に投与することを含む、アルブミン / クレアチニン比 (A C R) の減少方法。

[5]

(a) カナグリフロジン及び (b) 1 種若しくは 2 種以上の A C E 阻害剤又は 1 種若しくは 2 種以上の A R B の組み合わせを含む治療上有効量の組合せ治療剤を、それを必要とする対象に投与することを含む、腎過剰濾過傷害の治療又は予防方法。

[6]

過剰濾過性糖尿病性腎症、腎過剰濾過、糸球体過剰濾過、同種移植腎過剰濾過、代償性過剰濾過、過剰濾過性慢性腎疾患、過剰濾過性急性腎不全、及び肥満からなる群から選択される病態又は障害の治療又は予防方法であって、治療上有効量の (a) カナグリフロジン及び (b) 1 種若しくは 2 種以上の A C E 阻害剤又は A R B を含む組合せ治療剤を、それを必要とする対象に投与することを含む、治療又は予防方法。

[7]

それを必要とする前記対象が、以下の病態：

(a) 真正糖尿病 (型とは無関係) 、

(b) 慢性腎疾患 (C K D) 、

(c) 急性腎不全 (A R F) 、

(d) 腎臓移植レシピエント、

(e) 腎臓移植ドナー、又は

(f) 腎臓を片側全部若しくは部分的に摘出された患者、又は

(g) ネフローゼ症候群

のうちの 1 つ又は 2 つ以上に該当すると診断されているか又はその症状を呈する、 [1

] に記載の方法。

[8]

それを必要とする前記対象が、真正糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、

[1] に記載の方法。

[9]

それを必要とする前記対象が、1 型真正糖尿病、2 型真正糖尿病、若年成人発症型糖尿病 (M O D Y) 、成人潜在性自己免疫性糖尿病 (L A D A) 、又は前糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、 [1] に記載の方法。

[1 0]

それを必要とする前記対象が、2 型真正糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、 [1] に記載の方法。

[1 1]

それを必要とする前記対象が、2 型真正糖尿病かつ血糖管理が不十分と診断されているか又はその症状を呈する、 [1] に記載の方法。

[1 2]

それを必要とする前記対象が、2型真正糖尿病及び糖尿病性腎症と診断されているか又はその症状を呈する、[1]に記載の方法。

[1 3]

それを必要とする前記対象が、GFRが $125\text{ ml / 分 / }1.73\text{ m}^2$ 以上と測定された患者である、[1]に記載の方法。

[1 4]

それを必要とする前記対象が、GFRが $140\text{ ml / 分 / }1.73\text{ m}^2$ 以上と測定された患者である、[1]に記載の方法。

[1 5]

それを必要とする前記対象が、

(1) 過体重、肥満、内臓脂肪型肥満及び腹部肥満からなる群から選択される病態のうちの1つ又は2つ以上に該当すると診断されている個体、或いは

(2) 以下の徴候のうちの1つ、2つ、又は3つ以上を呈する個体：

(a) 空腹時血中グルコース濃度又は血清グルコース濃度が約 100 mg / dL 超、特に約 125 mg / dL 超、

(b) 食後血漿グルコースが約 140 mg / dL 以上、

(c) HbA1c値が約7.0%以上、

(3) 以下の病態のうちの1つ、2つ、3つ、又は4つ以上が存在する個体：

(a) 肥満、内臓脂肪型肥満及び/又は腹部肥満、

(b) トリグリセリド血中濃度が約 150 mg / dL 以上、

(c) HDLコレステロール血中濃度が、女性患者では約 40 mg / dL 未満、男性患者では約 50 mg / dL 未満、

(d) 収縮期血圧が約 17 kPa (130 mmHg) 以上、かつ拡張期血圧が約 11 kPa (85 mmHg) 以上、

(e) 空腹時血中グルコース濃度が約 100 mg / dL 以上、或いは

(4) 肥満の個体

である、[1]に記載の方法。

[1 6]

前記カナグリフロジンが、結晶性半水和物として存在する、[1]に記載の方法。

[1 7]

前記カナグリフロジンが、約 $100\sim 300\text{ mg}$ の範囲の量で投与される、[1]に記載の方法。

[1 8]

前記ACE阻害剤が、ベナゼプリル、カプトプリル、エナラプリル、リシノプリル、イミダプリル及びラミプリルからなる群から選択される、[1]に記載の方法。

[1 9]

前記ACE阻害剤が、エナラプリル、イミダプリル、リシノプリル及びラミプリルからなる群から選択される、[1]に記載の方法。

[2 0]

前記ARBが、カンデサルタン、イルベサルタン、ロサルタン及びバルサルタンからなる群から選択される、[1]に記載の方法。

[2 1]

前記ARBが、イルベサルタン及びロサルタンからなる群から選択される、[1]に記載の方法。

[2 2]

(a) カナグリフロジン及び(b) 1種若しくは2種以上のACE阻害剤又は1種若しくは2種以上のARBを含む治療上有効量の組合せ治療剤を、それを必要とする対象に投与することを含む、脂肪性肝障害の治療又は予防方法。

[2 3]

前記脂肪性肝障害が、アルコール性単純性脂肪肝、アルコール性脂肪性肝炎（ASH）、アルコール性肝線維症、アルコール性肝硬変、非アルコール性脂肪性肝疾患（NAFLD）、非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）、非アルコール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、[2 2]に記載の方法。

[2 4]

前記脂肪性肝障害が、非アルコール性脂肪性肝疾患（NAFLD）、非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）、非アルコール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、[2 2]に記載の方法。

[2 5]

前記脂肪性肝障害が、NAFLD及びNASHからなる群から選択される、[2 2]に記載の方法。

[2 6]

それを必要とする前記対象が、

真正糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[2 2]に記載の方法。

[2 7]

それを必要とする前記対象が、1型真正糖尿病、2型真正糖尿病、若年成人発症型糖尿病（MODY）、成人潜在性自己免疫性糖尿病（LADA）、又は前糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[2 2]に記載の方法。

[2 8]

それを必要とする前記対象が、2型真正糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[2 2]に記載の方法。

[2 9]

前記カナグリフロジンが結晶性半水和物として存在する、[2 2]に記載の方法。

[3 0]

前記カナグリフロジンが、約100～約300mgの範囲の量で投与される、[2 2]に記載の方法。

[3 1]

前記ACE阻害剤が、ベナゼプリル、カプトプリル、エナラプリル、イミダプリル、リシノプリル及びラミプリルからなる群から選択される、[2 2]に記載の方法。

[3 2]

前記ACE阻害剤が、エナラプリル、イミダプリル、リシノプリル及びラミプリルからなる群から選択される、[2 2]に記載の方法。

[3 3]

前記ARBが、カンデサルタン、イルベサルタン、ロサルタン及びバルサルタンからなる群から選択される、[2 2]に記載の方法。

[3 4]

前記ARBが、イルベサルタン及びロサルタンからなる群から選択される、[2 2]に記載の方法。

[3 5]

(a)カナグリフロジン及び(b)1種若しくは2種以上のACE阻害剤又は1種若しくは2種以上のARBと、医薬的に許容される担体と、を含む、医薬組成物。

[3 6]

前記カナグリフロジンが、結晶性半水和物として存在する、[3 5]に記載の医薬組成物。

[3 7]

前記カナグリフロジンが、約50～約500mgの範囲の量である、[3 5]に記載の医薬組成物。

[3 8]

前記カナグリフロジンが、約100～約300mgの範囲の量である、[3 5]に記載

の医薬組成物。

[3 9]

前記 A C E 阻害剤が、ベナゼプリル、カプトプリル、エナラプリル、イミダプリル、リシノプリル及びラミプリルからなる群から選択される、[3 5] に記載の医薬組成物。

[4 0]

前記 A C E 阻害剤が、エナラプリル、イミダプリル、リシノプリル及びラミプリルからなる群から選択される、[3 5] に記載の医薬組成物。

[4 1]

前記 A R B が、カンデサルタン、イルベサルタン、ロサルタン及びバルサルタンからなる群から選択される、[3 5] に記載の医薬組成物。

[4 2]

前記 A R B が、イルベサルタン及びロサルタンからなる群から選択される、[3 5] に記載の医薬組成物。

[4 3]

(a) カナグリフロジン及び (b) 1 種若しくは 2 種以上の P P A R 作動薬を含む治療上有効量の組合せ治療剤を、それを必要とする対象に投与することを含む、脂肪性肝障害の治療又は予防方法。

[4 4]

前記脂肪性肝障害が、アルコール性単純性脂肪肝、アルコール性脂肪性肝炎 (A S H) 、アルコール性肝線維症、アルコール性肝硬変、非アルコール性脂肪性肝疾患 (N A F L D) 、非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎 (N A S H) 、非アルコール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、[4 3] に記載の方法。

[4 5]

前記脂肪性肝障害が、非アルコール性脂肪性肝疾患 (N A F L D) 、非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎 (N A S H) 、非アルコール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、[4 3] に記載の方法。

[4 6]

前記脂肪性肝障害が、N A F L D 及び N A S H からなる群から選択される、[4 3] に記載の方法。

[4 7]

それを必要とする前記対象が、

真正糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[4 3] に記載の方法。

[4 8]

それを必要とする前記対象が、1 型真正糖尿病、2 型真正糖尿病、若年成人発症型糖尿病 (M O D Y) 、成人潜在性自己免疫性糖尿病 (L A D A) 、又は前糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[4 3] に記載の方法。

[4 9]

それを必要とする前記対象が、2 型真正糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[4 3] に記載の方法。

[5 0]

前記カナグリフロジンが、結晶性半水和物として存在する、[4 3] に記載の方法。

[5 1]

前記カナグリフロジンが、約 1 0 0 ~ 約 3 0 0 m g の範囲の量で投与される、[4 3] に記載の方法。

[5 2]

前記 P P A R 作動薬が、ピオグリタゾン、リボグリタゾン、ロシグリタゾン、トログリタゾン、ネトグリタゾン及びシグリタゾンからなる群から選択される、[4 3] に記載の方法。

[5 3]

前記 P P A R 作動薬が、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン及びトログリタゾンからなる群から選択される、[4 3]に記載の方法。

[5 4]

(a) カナグリフロジン及び

(b) 1 種若しくは 2 種以上の P P A R 作動薬と、医薬的に許容される担体と、を含む、医薬組成物。

[5 5]

前記カナグリフロジンが、結晶性半水和物として存在する、[5 4]に記載の医薬組成物。

[5 6]

前記カナグリフロジンが、約 5 0 ~ 約 5 0 0 m g の範囲の量である、[5 4]に記載の医薬組成物。

[5 7]

前記カナグリフロジンが、約 1 0 0 ~ 約 3 0 0 m g の範囲の量である、[5 4]に記載の医薬組成物。

[5 8]

前記 P P A R 作動薬が、ピオグリタゾン、リボグリタゾン、ロシグリタゾン、トログリタゾン、ネトグリタゾン及びシグリタゾンからなる群から選択される、[5 4]に記載の医薬組成物。

[5 9]

前記 P P A R 作動薬が、ピオグリタゾン、ロシグリタゾン及びトログリタゾンからなる群から選択される、[5 4]に記載の医薬組成物。

[6 0]

治療上有効量のカナグリフロジンを、それを必要とする対象に投与することを含む、脂肪性肝障害の治療又は予防方法。

[6 1]

前記脂肪性肝障害が、アルコール性単純性脂肪肝、アルコール性脂肪性肝炎 (A S H)、アルコール性肝線維症、アルコール性肝硬変、非アルコール性脂肪性肝疾患 (N A F L D)、非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎 (N A S H)、非アルコール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、[6 0]に記載の方法。

[6 2]

前記脂肪性肝障害が、非アルコール性脂肪性肝疾患 (N A F L D)、非アルコール性単純性脂肪肝、非アルコール性脂肪性肝炎 (N A S H)、非アルコール性肝線維症、及び非アルコール性肝硬変からなる群から選択される、[6 0]に記載の方法。

[6 3]

前記脂肪性肝障害が、N A F L D 及び N A S H からなる群から選択される、[6 0]に記載の方法。

[6 4]

それを必要とする前記対象が、真正糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[6 0]に記載の方法。

[6 5]

それを必要とする前記対象が、1 型真正糖尿病、2 型真正糖尿病、若年成人発症型糖尿病 (M O D Y)、成人潜在性自己免疫性糖尿病 (L A D A)、又は前糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[6 0]に記載の方法。

[6 6]

それを必要とする前記対象が、2 型真正糖尿病と診断されているか又はその症状を呈する、[6 0]に記載の方法。

[6 7]

前記カナグリフロジンが、結晶性半水和物として存在する、[6 0]に記載の方法。

[6 8]

前記カナグリフロジンが、約 5 0 ~ 約 5 0 0 m g の範囲の量で投与される、[6 0] に記載の方法。

[6 9]

前記カナグリフロジンが、約 1 0 0 ~ 約 3 0 0 m g の範囲の量で投与される、[6 0] に記載の方法。