

【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27年2月19日 (2015.2.19)

【公表番号】特表2014-505049(P2014-505049A)

【公表日】平成26年2月27日 (2014.2.27)

【年通号数】公開・登録公報2014-011

【出願番号】特願2013-547780(P2013-547780)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/26	(2006.01)
A 6 1 P	5/42	(2006.01)
A 6 1 P	3/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/44	(2006.01)
A 6 1 K	9/28	(2006.01)
A 6 1 K	9/70	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/72	(2006.01)
A 6 1 K	31/28	(2006.01)
A 6 1 K	31/537	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 K	31/4178	(2006.01)
G 0 1 N	33/15	(2006.01)
G 0 1 N	33/50	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	45/06	
A 6 1 P	43/00	1 1 1

A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/06	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	25/26	
A 6 1 P	5/42	
A 6 1 P	3/12	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 K	47/38	
A 6 1 K	47/44	
A 6 1 K	9/28	
A 6 1 K	9/70	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/42	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	9/48	
A 6 1 K	9/10	
A 6 1 K	9/72	
A 6 1 K	31/28	
A 6 1 K	31/537	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 K	31/4178	
G 0 1 N	33/15	Z
G 0 1 N	33/50	Z

【手続補正書】**【提出日】**平成26年12月19日(2014.12.19)**【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】**

医薬組成物であって、

a) 少なくとも1種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩、
および

b) 少なくとも1種のケモカイン受容体 2 (C C R 2) 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩、
を含む医薬組成物。

【請求項2】

前記 C C R 2 経路阻害薬が

a) C C R 2 を阻害するか、または部分的に阻害する、
b) 直接的な C C R 2 アンタゴニスト、インバース C C R 2 アゴニスト、ネガティブアロステリック C C R 2 調節薬、間接的な C C R 2 アンタゴニスト、間接的なインバース C C R 2 アゴニスト、および間接的なネガティブアロステリック C C R 2 調節薬、を含む群から選択される、および / または

c) プロパゲルマニウム、R S 1 0 2 8 9 5、M L N - 1 2 0 2、I N C B 8 6 9 6、M K - 0 8 1 2、C C X 1 4 0、P F - 4 1 3 6 3 0 9、および B M S - 7 4 1 6 7 2、を含む群から選択される、

請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

a) 少なくとも1種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩、
および

b) 少なくとも1種の、ケモカイン受容体以外の C C R 2 経路の成分を阻害する C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩、
を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記 C C R 2 経路阻害薬が、

(i) C C R 2 またはケモカイン受容体以外の C C R 2 経路の成分のアンタゴニスト、
(i i) C C R 2 またはケモカイン受容体以外の C C R 2 経路の成分のインバースアゴニスト、
(i i i) C C R 2 またはケモカイン受容体以外の C C R 2 経路の成分のネガティブアロステリック調節薬、
からなる群から選択される、請求項1または請求項3に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記 C C R 2 経路阻害薬が、

a) M C P - 1 誘発遊走および単球活性化および走化性遊走を阻害する、および / または
b) 複合体 C C R 2 / C D 5 5、C C R 2 / C D 5 9、および / または C C R 2 / C D 1 6 を安定化する、

請求項1、3または4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記 C C R 2 経路阻害薬が、C D 5 5、C D 5 9 および C D 1 6 を含む群から選択される1種または複数のグリコシルホスファチジルイノシトール (G P I) アンカー型タンパク質を標的化することを介して、M C P - 1 誘発遊走および単球活性化および走化性遊走を阻害する、請求項5に記載の医薬組成物。

【請求項7】

前記アンジオテンシン受容体遮断薬が、

a) アンジオテンシン受容体の活性化を阻害するか、または部分的に阻害する、
b) 前記アンジオテンシン受容体がアンジオテンシン受容体1 (A T 1 R ; A T ₁ R) またはアンジオテンシン受容体2 (A T 2 R ; A T ₂ R) である、

c) 前記アンジオテンシン受容体遮断薬が、
i) アンジオテンシン受容体アンタゴニスト；
i i) アンジオテンシン受容体インバースアゴニスト；および
i i i) アンジオテンシン受容体ネガティブアロステリック調節薬
を含む群から選択される、および / または

d) 前記アンジオテンシン受容体遮断薬が、イルベサルタン (A T ₁ R)、C G P - 4 2

1 1 2 A (A T₂ R アンタゴニスト)、エプロサルタン (A T₁ R)、ロサルタン (A T₁ R)、バルサルタン (A T₁ R)、テルミサルタン (A T₁ R)、カンデサルタン (A T₁ R)、オルメサルタン (A T₁ R)、PD 1 2 3 3 1 9 (A T₂ R)、Z D - 7 1 1 5 (A T₁ R)、サララシン ((S a r¹ - A l a⁸) A n g I I)、サルスラン ((S a r¹ - T h r⁸) A n g I I) および D u P 7 5 3 (A T₁ R)、を含む群から選択される、

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

a) 請求項 2 の (c) に記載のいずれかの化合物、および

b) 請求項 7 の (d) に記載のいずれかの化合物

を含む、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

疾患または状態を治療、改善または予防するための医薬組成物の全体効力が

a) 他の成分を何ら投与することなくいずれかの成分を投与した場合の前記アンジオテンシン受容体遮断薬または前記 C C R 2 経路阻害薬の効力と比較して、より大きい、

b) 他の成分を何ら投与することなくいずれかの成分を投与した場合の前記アンジオテンシン受容体遮断薬および前記 C C R 2 経路阻害薬の効力の合計と比較して、より大きい、

c) 他の成分を何ら投与することなくいずれかの成分を投与した場合の前記アンジオテンシン受容体遮断薬および前記 C C R 2 経路阻害薬の効力の合計に等しい、

請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

疾患または状態を治療、改善または予防するための前記医薬組成物の合わせた効力が、他の成分を何ら投与することなくいずれかの成分を投与した場合の前記アンジオテンシン受容体遮断薬および前記 C C R 2 経路阻害薬の効力の合計未満であり、前記治療が、単独で投与されるアンジオテンシン受容体遮断薬または前記 C C R 2 経路阻害薬の単独治療と比較してより大きな効力をもたらす、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

疾患の治療、改善または予防のための医薬品において使用するための、剤形の、少なくとも 1 種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩であって、任意選択で、同時に投与されるか、または順次に投与される、少なくとも 1 種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 12】

前記少なくとも 1 種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および前記少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩が、同時に投与される、請求項 11 に記載の使用のための、少なくとも 1 種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 13】

前記少なくとも 1 種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および前記少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩が、順次に投与され、任意選択で、互いに数秒、数分、数日、数週間または数ヶ月以内に順次投与される、請求項 11 に記載の使用のための、少なくとも 1 種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 14】

前記少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩が、請求項 2 ~ 6 または 8 のいずれか 1 項により規定される C C R 2 経路阻害薬であり、および / または、

前記少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩が請求項 7 または 8 のいずれか 1 項により規定される、

請求項 1 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の使用のための、少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および少なくとも１種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 5】

少なくとも１種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩と同時に、または順次に、対象に投与される、疾患の治療または予防のための医薬品において使用するための少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 6】

少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩と同時に、または順次に、対象に投与される、疾患の治療、改善または予防のための医薬品において使用するための少なくとも１種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 7】

前記少なくとも１種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩が、請求項 2 ～ 6 または 8 のいずれか 1 項により規定される C C R 2 経路阻害薬であり、および / または、

前記少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩が請求項 7 または 8 により規定される、

請求項 1 5 に記載の使用のための少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩、または、請求項 1 6 に記載の使用のための少なくとも１種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 8】

前記少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩、および / または、前記少なくとも１種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩が、剤形である、

請求項 1 5 または 1 7 に記載の使用のための少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩、または、請求項 1 6 または 1 7 に記載の使用のための少なくとも１種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 9】

治療、改善または予防される前記疾患が、腎臓における繊維性障害、糖尿病性腎障害が原因の慢性腎臓疾患、腎不全、腎不全状態、糖尿病性腎障害、糸球体腎炎、強皮症、糸球体硬化症、一次腎疾患のタンパク尿、腎臓血管高血圧、心臓血管疾患、慢性心不全、高血圧、鬱血性心不全、左心室機能不全、肥大性心筋症、糖尿病性心筋症、上室性および心室性不整脈、心房性原線維形成、心房性粗動、心筋梗塞およびその続発症、アテローム硬化症、アンギナ、心不全、狭心症、二次アルドステロン症、一次および二次肺高アルドステロン症、一次肺高血圧、糖尿病性網膜症、インスリン耐性、血管障害、片頭痛、レイノー病、管腔過形成、認知機能不全、アルツハイマー病、卒中、高カリウム血症、子癇前症、サルコイドーシス、糖尿病、黄斑変性症、H I V 感染、A I D S 発症、虚血および再灌流障害、アテローム発生、慢性閉塞性肺疾患、喘息、アレルギー性腎疾患および関節リウマチを含む群から選択される疾患である、請求項 1 1 ～ 1 8 のいずれか 1 項に記載の使用のための、少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および / または少なくとも１種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 2 0】

前記剤形が前記アンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩約 5 m g から 1 g および前記 C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩約 5 m g から 1 g を含む、請求項 1 1 ～ 1 4 および 1 8 のいずれか 1 項に記載の使用のための、少なくとも１種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および / また

は少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 2 1】

前記 C C R 2 経路阻害薬がプロバゲルマニウムまたは C C X 1 4 0 である、請求項 1 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の使用のための、少なくとも 1 種のアンジオテンシン受容体遮断薬または薬学的に許容されるその塩および / または少なくとも 1 種の C C R 2 経路阻害薬または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 2 2】

治療上有効な、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物および放出遅延剤を含む、経口徐放性医薬組成物または注射用徐放性医薬組成物。

【請求項 2 3】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物を含む注射用懸濁剤。

【請求項 2 4】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物を含む肺送達用または経鼻送達用の組成物。