

【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25年8月8日 (2013.8.8)

【公表番号】特表2012-531420(P2012-531420A)

【公表日】平成24年12月10日 (2012.12.10)

【年通号数】公開・登録公報2012-052

【出願番号】特願2012-517679(P2012-517679)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/215 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 31/13 (2006.01)

A 6 1 K 38/21 (2006.01)

A 6 1 K 38/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/7088 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

C 0 7 D 277/20 (2006.01)

C 0 7 D 277/58 (2006.01)

C 0 7 D 277/46 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/426

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 39/12

A 6 1 K 31/215

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 31/13

A 6 1 K 37/66 G

A 6 1 K 37/54

A 6 1 K 31/7088

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/16

C 0 7 D 277/58

C 0 7 D 277/46

【手続補正書】

【提出日】平成25年6月21日 (2013.6.21)

【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

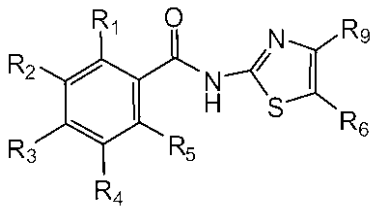
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

i) 治療有効量の式 I の化合物、またはその塩またはそのエステル

【化 1】



式 I

[式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 の 1 つは、 OH または $OC(=O)Q$ であり、ここで、 Q は、 R_7 、 OR_7 、または NHR_7 であり； R_7 は低級アルキル、アリール、またはヘテロアリールであり、場合によって置換されており； R_4 、 R_5 、ならびに R_1 、 R_2 、および R_3 の残りは、独立に、 H 、ハロ、低級アルコキシ、または低級アルキルであり； R_6 が NO_2 であり、 R_9 が H である、または R_6 が H であり、 R_9 が SO_2R_{12} であり、ここで、 R_{12} は、低級アルキル、アリール、またはヘテロアリールであり、場合によって置換されている]

および

ii) 薬学的に許容される賦形剤

を含む、インフルエンザウイルス感染またはインフルエンザウイルス様疾患の予防または治療のための医薬組成物。

【請求項 2】

R_1 、 R_2 、 R_3 の 1 つが、 OH または $OC(=O)Q$ であり、ここで、 Q は、 R_7 、 OR_7 、または NHR_7 であり； R_7 は、低級アルキル、アリール、またはヘテロアリールであり、場合によって置換されており； R_4 、 R_5 、ならびに R_1 、 R_2 、および R_3 の残りが、 H であり； R_6 が NO_2 であり、 R_9 が H である、または R_6 が H であり、 R_9 が SO_2R_{12} であり、ここで、 R_{12} は、低級アルキル、アリール、またはヘテロアリールであり、場合によって置換されている、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記化学式 1 の化合物が表 6 で示される化合物である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

式 I の化合物を、ノイラミニダーゼ阻害薬、ワクチン、免疫賦活薬、アダマンチン類似体、組換えシアリダーゼ融合タンパク質、アンチセンスオリゴヌクレオチドまたは、ペグ化インターフェロンと組み合わせて投与する、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記化学式 1 の化合物がワクチンおよび免疫賦活薬の組み合わせで投与される、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

ノイラミニダーゼ阻害薬が、オセルタミビル、ザナミビル、ペルミビル、RWJ - 270201、DANA、および CS - 8958 からなる群から選択されるか；前記アダマンチン類似体が、アマンタジンおよびリマンタジンからなる群から選択されるか；免疫賦活薬がポリオキシドニウムであるか；組換えシアリダーゼ融合タンパク質が Fludase (登録商標) であるか；または、アンチセンスオリゴヌクレオチドが Neugene (登録商標) アンチセンスホスホロジアミデートモルホリノオリゴマーを含む、請求項 4 または 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

組み合わせを、逐次的なやり方または実質的に同時の方式で投与する、請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記予防または治療がインフルエンザウイルスの感染に対するものである、請求項 1 ~

7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項9】

インフルエンザウイルス感染症が、H1N1、H2N2、H3N2、H5N1、H7N7、H1N2、H9N2、H7N2、H7N3、およびH10N7から選択されるウイルスによって引き起こされる、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項10】

インフルエンザ治療のための、(a)請求項1～3のいずれか1項に規定される化学式Iの化合物または薬学的に許容されるその塩、および(b)ノイラミニダーゼ阻害薬、免疫賦活薬、アダマンチン類似体、組換えシアリダーゼ融合タンパク質、または、アンチセンスオリゴヌクレオチドを含むキット。

【請求項11】

前記ノイラミニダーゼ阻害薬が、オセルタミビル、ザナミビル、ベルミビル、RWJ-270201、DANA、およびCS-8958からなる群から選択されるか；前記アダマンチン類似体が、アマンタジンおよびリマンタジンからなる群から選択されるか；免疫賦活薬がポリオキシドニウムであり；組換えシアリダーゼ融合タンパク質がFludase（登録商標）であるか；または、アンチセンスオリゴヌクレオチドが、Neugene（登録商標）アンチセンスホスホロジアミデートモルホリノオリゴマーである、請求項10に記載のキット。

【請求項12】

ウイルス糖タンパク質の成熟をブロックする化合物または薬学的に許容されるその塩もしくはエステルの治療有効量を含む、インフルエンザ感染の治療に用いるための、医薬組成物。

【請求項13】

エンドグリコシダーゼ-H消化に対する抵抗性に先行する段階でウイルス血球凝集素の成熟をブロックする化合物または薬学的に許容されるその塩もしくはエステルの治療有効量を含むインフルエンザ感染の治療に用いるための、医薬組成物。

【請求項14】

前記化合物が、請求項1～3のいずれか1項に記載の式Iの化合物または薬学的に許容されるその塩もしくはエステルである、請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項15】

請求項1に記載の式Iの化合物または薬学的に許容されるその塩もしくはエステルの治療有効量を含む、ヒトまたは他の哺乳動物における感染性ウイルス粒子の産生を妨害または防止するために用いられる、医薬組成物。

【請求項16】

式Iの化合物との相乗効果をもたらすのに十分な量の他の抗ウイルス薬またはワクチンをさらに含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項17】

請求項1～3のいずれか1項で規定される式Iの化合物または薬学的に許容されるその塩の治療有効量、および薬学的に許容される賦形剤を含む、インフルエンザ様疾患の治療に用いるための、医薬組成物。

【請求項18】

前記組成物が、経口的に投与される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項19】

前記化学式Iで表される化合物が100mg、200mg、300mg、400mg、500mgおよび600mgからなる群から選択される用量で投与される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項20】

前記組成物が1日2回で投与され、化学式Iで表される化合物を300mgおよび600mgからなる群から選択される用量を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項21】

前記組成物が5日以上投与されず、化学式Ⅰの組成物を300mgの用量で含む、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項22】

前記化合物Ⅰの組成物がニタゾキサニドであり、前記ニタゾキサニドが、300mg用量で、1日2回投与される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項23】

前記ニタゾキサニドが調節放出二重層錠剤として投与される、請求項22に記載の医薬組成物。