

【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23年8月18日(2011.8.18)

【公表番号】特表2010-532383(P2010-532383A)

【公表日】平成22年10月7日(2010.10.7)

【年通号数】公開・登録公報2010-040

【出願番号】特願2010-515241(P2010-515241)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/549 (2006.01)
C 0 7 D 285/24 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 K 47/34 (2006.01)
A 6 1 K 47/38 (2006.01)
A 6 1 K 31/216 (2006.01)
A 6 1 K 31/455 (2006.01)
A 6 1 K 31/4453 (2006.01)
A 6 1 K 31/4985 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/7034 (2006.01)
A 6 1 K 31/662 (2006.01)
A 6 1 K 31/4035 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 1/18 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/06 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 15/08 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/549
C 0 7 D 285/24
A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 47/34
A 6 1 K 47/38
A 6 1 K 31/216
A 6 1 K 31/455
A 6 1 K 31/4453
A 6 1 K 31/4985
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/7034
A 6 1 K 31/662
A 6 1 K 31/4035
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 15/08

【手続補正書】

【提出日】平成23年7月1日(2011.7.1)

【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

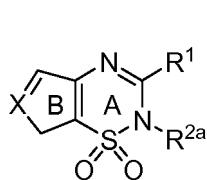
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

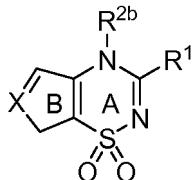
【請求項1】

塩を含み、当該塩が：

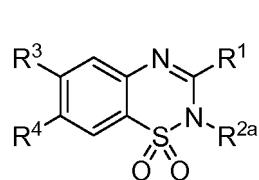
式I、式II、式III、及び式IV：



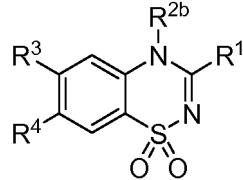
式I



式II



式III



式IV

からなる群から選択されるK_{ATP}チャネル開口薬のアニオンであって、式I及びIIにおいて：

R¹が水素、C₁ないしC₆アルキル、置換型のC₁ないしC₆アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、R¹が置換型のC₁ないしC₆アルキル又は置換型のシクロアルキルである場合に置換基がアミノ基を含まず；

R^{2a}が水素であり；

R^{2b}が水素であり；

Xが1、2、又は3原子の鎖であり、各原子が炭素、硫黄、及び窒素から独立して選択され、各原子がハロゲン、ヒドロキシリル、C₁ないしC₆アルキル、置換型のC₁ないしC₆アルキル、C₁ないしC₆アルコキシ、シクロアルキル、置換型のシクロアルキル、又は置換型のC₁ないしC₆アルコキシで任意に置換されるが、前記鎖の原子が、置換型のC₁ないしC₆アルキル、置換型のC₁ないしC₆アルコキシ、又は置換型のシクロアルキルで置換されている場合に置換基がアミノ基を含まず；

環Bが飽和型、一価不飽和型、多価不飽和型、又は芳香族であり；

式III及びIVにおいて：

R¹が水素、C₁ないしC₆アルキル、置換型のC₁ないしC₆アルキル、及びシクロアルキルからなる群から選択されるが、R¹が置換型のC₁ないしC₆アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まず；

R^{2a}が水素であり；

R^{2b}が水素であり；

R³が水素、ハロゲン、C₁ないしC₆アルキル、置換型のC₁ないしC₆アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、R³が置換型のC₁ないしC₆アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まず；

R⁴が水素、ハロゲン、C₁ないしC₆アルキル、置換型のC₁ないしC₆アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、R⁴が置換型のC₁ないしC₆アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まない；

アニオンと；

アルカリ金属と；

第三級アミンの官能基を有するアンモニウムを含む化合物と；

からなる群から選択されるカチオンと；

を含む製剤からなる群から選択されることを特徴とする、

(a) 肥満体の被験者の血中総コレステロールレベルを低下させ；及び／又は

(b) 肥満体又は健常体の被験者の血中HDLコレステロールレベルを上昇させる

ための医薬組成物の製造のための製剤の使用。

【請求項2】

請求項1に記載の使用において、前記被験者が脂質異常症又は非アルコール性脂肪性肝炎に罹患していることを特徴とする請求項1に記載の使用。

【請求項3】

請求項1に記載の使用において、前記被験者が脂質異常症及び／又は脾炎の危険があることを特徴とする使用。

【請求項4】

請求項1に記載の使用において、前記被験者が肥満であることを特徴とする使用。

【請求項5】

請求項1に記載の使用において、前記製剤が24時間あたり1回投与されるか、あるいは前記製剤が24時間あたり2回投与されることを特徴とする使用。

【請求項6】

請求項1ないし5のいずれか1項に記載の使用において、前記K_{ATP}チャネル開口薬がジアゾキシドコリンであることを特徴とする使用。

【請求項7】

請求項1ないし6のいずれか1項に記載の使用において：

前記製剤が、式I、式II、式III及び式IVからなる群から選択されるK_{ATP}チャネル開口薬の塩以外の薬剤を更に含み、当該K_{ATP}チャネル開口薬の塩以外の薬剤が被験者の血中総コレステロールレベルを低下させること、及び／又は被験者の血中HDLコレステロールレベルを上昇させることに有効であるか；

あるいは、

前記被験者が、式I、式II、式III及び式IVからなる群から選択される、K_{ATP}チャネル開口薬の塩以外の薬剤を同時投与され、前記K_{ATP}チャネル開口薬の塩以外の薬剤が被験者の血中総コレステロールレベルを低下させること、及び／又は被験者の血中HDLコレステロールレベルを上昇させることに有効である；

ことを特徴とする使用。

【請求項8】

請求項1に記載の使用において、前記製剤がHMG-CoAリダクターゼ阻害剤を更に含み、当該HMG-CoAリダクターゼ阻害剤が好適にはスタチンであることを特徴とする使用。

【請求項9】

請求項1に記載の使用において：

前記製剤がフィブラーントを更に含むか；

前記製剤が甲状腺受容体活性剤を更に含むか；

前記製剤がMTP阻害剤を更に含むか；あるいは

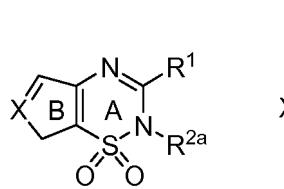
前記製剤がスクアレンシンターゼ阻害剤を更に含む；

ことを特徴とする使用。

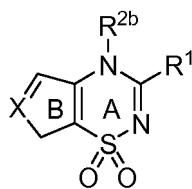
【請求項10】

塩を含み、当該塩が：

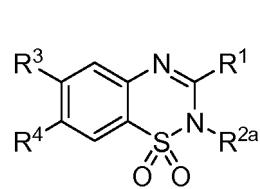
式I、式II、式III、及び式IV：



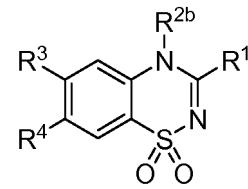
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャネル開口薬のアニオンであって、式 I 及び II において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキル又は置換型のシクロアルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；

R^{2b} が水素であり；

X が 1、2、又は 3 原子の鎖であり、各原子が炭素、硫黄、及び窒素から独立して選択され、各原子がハロゲン、ヒドロキシリル、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、 C_1 ないし C_6 アルコキシ、シクロアルキル、置換型のシクロアルキル、又は置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシで任意に置換されるが、前記鎖の原子が、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシ、又は置換型のシクロアルキルで置換されている場合に置換基がアミノ基を含ます；

環 B が飽和型、一価不飽和型、多価不飽和型、又は芳香族であり；

式 II 及び IV において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、及びシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；

R^{2b} が水素であり；

R^3 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^3 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まず；

R^4 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^4 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まない；

アニオンと；

アルカリ金属と；

第三級アミンの官能基を有するアンモニウムを含む化合物と；

からなる群から選択されるカチオンと；

を含む製剤からなる群から選択されることを特徴とする、

1型糖尿病に罹患している被験者において：

(a) インスリン投与量を低減するか；あるいは

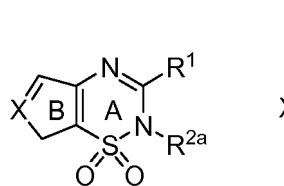
(b) 残存インスリン分泌の喪失を遅らせる；

ための医薬組成物の製造のための製剤の使用。

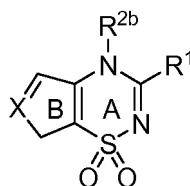
【請求項 11】

塩を含み、当該塩が：

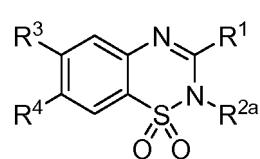
式 I、式 II、式 III、及び式 V：



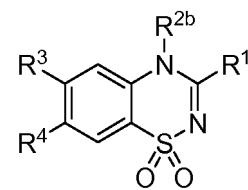
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャネル開口薬のアニオンであって、式 I 及び II において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキル又は置換型のシクロアルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；
 R^{2b} が水素であり；

X が 1、2、又は 3 原子の鎖であり、各原子が炭素、硫黄、及び窒素から独立して選択され、各原子がハロゲン、ヒドロキシリル、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、 C_1 ないし C_6 アルコキシ、シクロアルキル、置換型のシクロアルキル、又は置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシで任意に置換されるが、前記鎖の原子が、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシ、又は置換型のシクロアルキルで置換されている場合に置換基がアミノ基を含ます；

環 B が飽和型、一価不飽和型、多価不飽和型、又は芳香族であり；

式 II 及び IV において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、及びシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；
 R^{2b} が水素であり；

R^3 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^3 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まず；

R^4 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^4 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まない；

アニオンと；

アルカリ金属と；

第三級アミンの官能基を有するアンモニウムを含む化合物と；

からなる群から選択されるカチオンと；

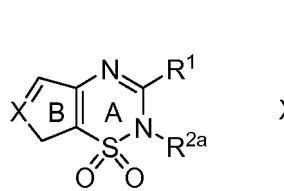
を含む製剤からなる群から選択され、インスリン分泌を刺激するか、あるいは短時間作用型抗糖尿病薬である抗糖尿病薬との同時投与によって 2 型糖尿病に罹患している被験者を治療するための医薬組成物の製造のための製剤の使用であって、

前記短時間作用型抗糖尿病薬がアカルボース、ミグリトール、レバグリニド、ナテグリニド、又はロシグリタゾンではない場合に前記短時間作用型抗糖尿病薬が投与後 30 分ないし 3 時間の最大効果と 5 時間未満の循環半減期とを有することを特徴とする使用。

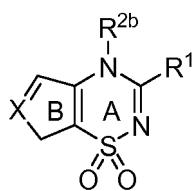
【請求項 12】

塩を含み、当該塩が：

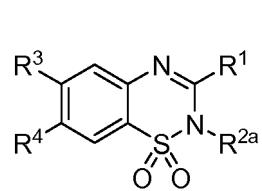
式 I、式 II、式 III、及び式 V：



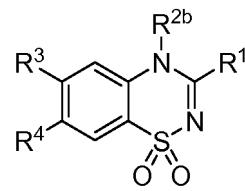
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャネル開口薬のアニオンであって、式 I 及び II において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキル又は置換型のシクロアルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；

R^{2b} が水素であり；

X が 1、2、又は 3 原子の鎖であり、各原子が炭素、硫黄、及び窒素から独立して選択され、各原子がハロゲン、ヒドロキシリル、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、 C_1 ないし C_6 アルコキシ、シクロアルキル、置換型のシクロアルキル、又は置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシで任意に置換されるが、前記鎖の原子が、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシ、又は置換型のシクロアルキルで置換されている場合に置換基がアミノ基を含ます；

環 B が飽和型、一価不飽和型、多価不飽和型、又は芳香族であり；

式 III 及び IV において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、及びシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；

R^{2b} が水素であり；

R^3 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^3 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まず；

R^4 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^4 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まない；

アニオンと；

アルカリ金属と；

第三級アミンの官能基を有するアンモニウムを含む化合物と；

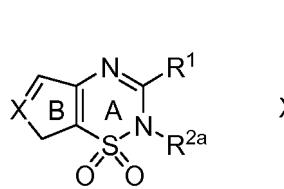
からなる群から選択されるカチオンと；

を含む製剤からなる群から選択されることを特徴とする、前記製剤及びアンドロゲン阻害剤の同時投与によって多囊胞性卵巣症候群に罹患している被験者を治療するための医薬組成物の製造のための製剤の使用。

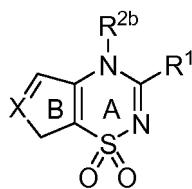
【請求項 1 3】

塩を含み、当該塩が：

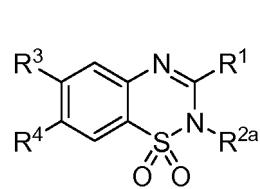
式 I、式 II、式 III、及び式 V：



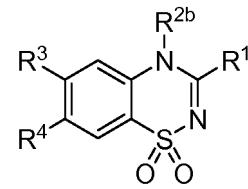
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャネル開口薬のアニオンであって、式 I 及び II において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキル又は置換型のシクロアルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；

R^{2b} が水素であり；

X が 1、2、又は 3 原子の鎖であり、各原子が炭素、硫黄、及び窒素から独立して選択され、各原子がハロゲン、ヒドロキシリル、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、 C_1 ないし C_6 アルコキシ、シクロアルキル、置換型のシクロアルキル、又は置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシで任意に置換されるが、前記鎖の原子が、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシ、又は置換型のシクロアルキルで置換されている場合に置換基がアミノ基を含ます；

環 B が飽和型、一価不飽和型、多価不飽和型、又は芳香族であり；

式 III 及び IV において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、及びシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；

R^{2b} が水素であり；

R^3 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^3 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まず；

R^4 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^4 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まない；

アニオンと；

アルカリ金属と；

第三級アミンの官能基を有するアンモニウムを含む化合物と；

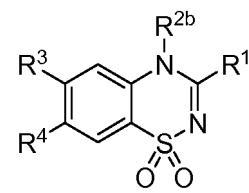
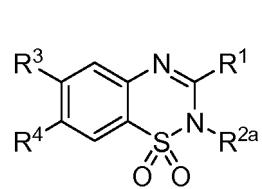
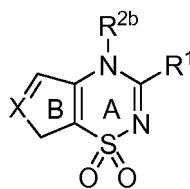
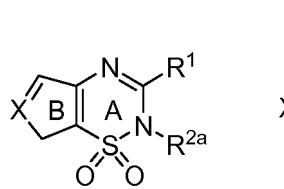
からなる群から選択されるカチオンと；

を含む製剤からなる群から選択され、総ての製剤が治療上有効な量のアンドロゲン阻害剤を更に含むことを特徴とする、多囊胞性卵巣症候群に罹患している被験者を治療するための医薬組成物の製造のための製剤の使用。

【請求項 1-4】

i) 塩を含み、当該塩が：

式 I、式 II、式 III、及び式 V：



からなる群から選択される K_{ATP} チャネル開口薬のアニオンであって、式 I 及び II において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキル又は置換型のシクロアルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；
 R^{2b} が水素であり；

X が 1、2、又は 3 原子の鎖であり、各原子が炭素、硫黄、及び窒素から独立して選択され、各原子がハロゲン、ヒドロキシリル、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、 C_1 ないし C_6 アルコキシ、シクロアルキル、置換型のシクロアルキル、又は置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシで任意に置換されるが、前記鎖の原子が、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルコキシ、又は置換型のシクロアルキルで置換されている場合に置換基がアミノ基を含ます；

環 B が飽和型、一価不飽和型、多価不飽和型、又は芳香族であり；

式 II 及び IV において：

R^1 が水素、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、及びシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^1 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含ます；

R^{2a} が水素であり；
 R^{2b} が水素であり；

R^3 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^3 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まず；

R^4 が水素、ハロゲン、 C_1 ないし C_6 アルキル、置換型の C_1 ないし C_6 アルキル、シクロアルキル、及び置換型のシクロアルキルからなる群から選択されるが、 R^4 が置換型の C_1 ないし C_6 アルキルである場合に置換基がアミノ基を含まない；

アニオンと；

アルカリ金属と；

第三級アミンの官能基を有するアンモニウムを含む化合物と；

からなる群から選択されるカチオンと；

を含む製剤；および

i i) 7 - クロロ - 3 - メチル - 2H - 1 , 2 , 4 - ベンゾチアジアインを含む製剤；からなる群から選択されることを特徴とする、低血糖に関連した自律神経障害に罹患している被験者を治療するための医薬組成物の製造のための製剤の使用。