

【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

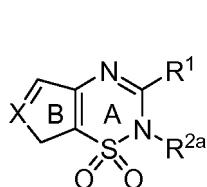
【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

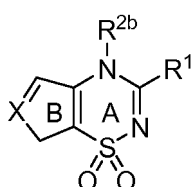
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

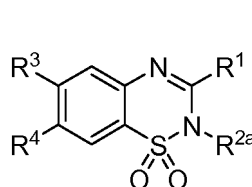
【請求項 1】

塩を含み、当該塩が：式 I、式 II、式 III、及び式 IV：

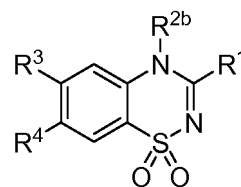
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャン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：

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ず；

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、
(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 H D L 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 / 又は膵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 2 4 時間あたり 1 回投与されるか、あるいは前記製剤が 2 4 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_{A T P} チャン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 I I、式 I I I 及び式 I V からなる群から選択される K_{A T P} チャンネル開口薬の塩以外の薬剤を更に含み、当該 K_{A T P} チャン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 H D L 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 I I、式 I I I 及び式 I V からなる群から選択される、K_{A T P} チャンネル開口薬の塩以外の薬剤を同時投与され、前記 K_{A T P} チャン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 H D L 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 H M G - C o A リダクターゼ阻害剤を更に含み、当該 H M G - C o A 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 M T P 阻害剤を更に含むか；あるいは

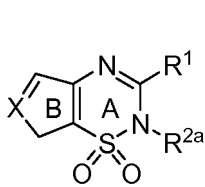
前記製剤がスクアレニンターゼ阻害剤を更に含む；

ことを特徴とする使用。

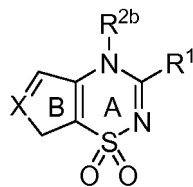
【請求項 10】

塩を含み、当該塩が：

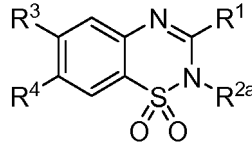
式 I、式 I I、式 I I I、及び式 I V；



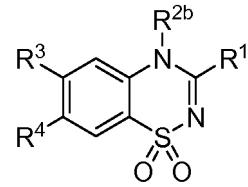
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャン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：

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ず；

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

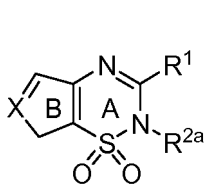
(b) 残存インスリン分泌の喪失を遅らせる；

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 IV；



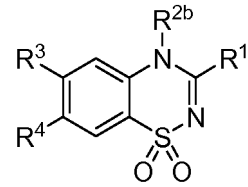
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャン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：

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ず；

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；

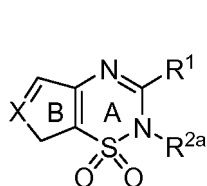
を含む製剤からなる群から選択され、インスリン分泌を刺激するか、あるいは短時間作用型抗糖尿病薬である抗糖尿病薬との同時投与によって 2 型糖尿病に罹患している被験者を治療するための医薬組成物の製造のための製剤の使用であって、

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。

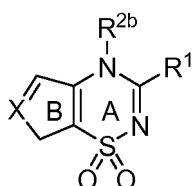
【請求項 12】

塩を含み、当該塩が：

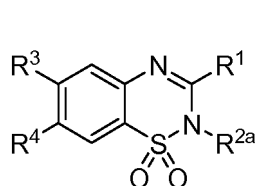
式 I、式 II、式 III、及び式 IV



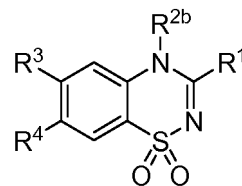
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャン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：

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ず；

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；

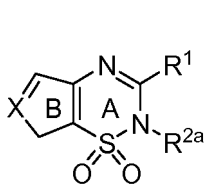
からなる群から選択されるカチオンと；

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嚢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。

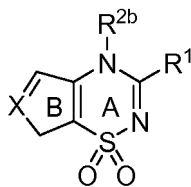
【請求項 13】

塩を含み、当該塩が：

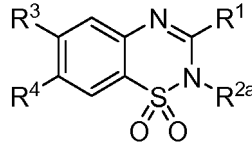
式 I、式 II、式 III、及び式 IV；



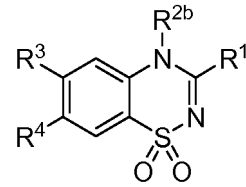
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャン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：

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ず；

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；

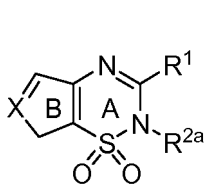
からなる群から選択されるカチオンと；

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、多嚢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。

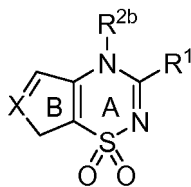
【請求項 14】

i) 塩を含み、当該塩が：

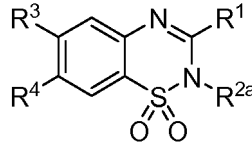
式 I、式 II、式 III、及び式 IV；



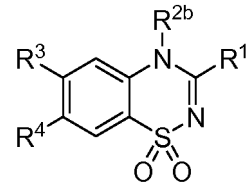
式 I



式 II



式 III



式 IV

からなる群から選択される K_{ATP} チャン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：

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ず；

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 - 2 H - 1, 2, 4 - ベンゾチアジアジンを含む製剤；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。