

【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2009-541220(P2009-541220A)

【公表日】平成21年11月26日 (2009.11.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-047

【出願番号】特願2009-515506(P2009-515506)

【国際特許分類】

C 0 7 D 339/04 (2006.01)

C 0 7 C 279/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/155 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 339/04

C 0 7 C 279/26 C S P

A 6 1 K 31/155

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 27/12

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年6月14日 (2010.6.14)

【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

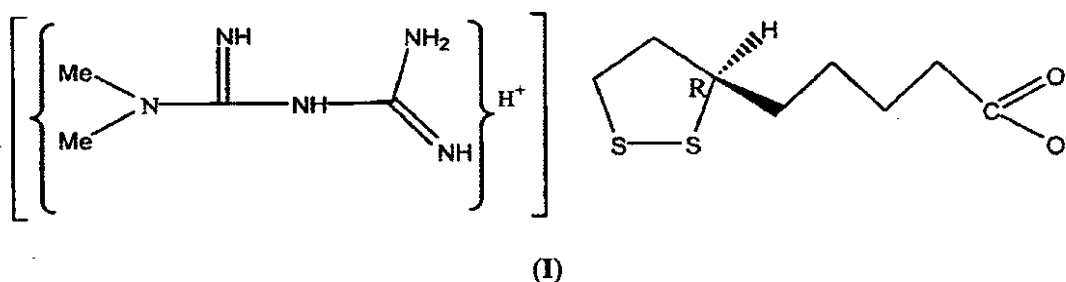
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

メトホルミン R - ( + ) リポエートである式 I の構造を有する化合物、または薬学的に許容できるその溶媒和物もしくは水和物。

【化 2】



## 【請求項 2】

単結晶 X 線回折により測定され、図 1 に描かれている結晶性固体である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

図 2 に描かれている粉末 X 線回折図を示す、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

メトホルミンの薬学的に許容できる塩および R - ( + ) リポ酸または薬学的に許容できるその塩を含む混合物。

## 【請求項 5】

メトホルミンの前記薬学的に許容できる塩が、塩酸メトホルミンである、請求項 4 に記載の混合物。

## 【請求項 6】

R - ( + ) リポ酸ナトリウムを含む、請求項 4 に記載の混合物。

## 【請求項 7】

請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物および薬学的に許容できる担体、ビヒクルまたは希釈剤を含む医薬組成物。

## 【請求項 8】

請求項 4 に記載の混合物および薬学的に許容できる担体、ビヒクルまたは希釈剤を含む医薬組成物。

## 【請求項 9】

キットであって、

a ) メトホルミン ( R ) - ( + ) - リポエートを含む単位剤形、またはメトホルミンの薬学的に許容できる塩と R - ( + ) - リポ酸または薬学的に許容できるその塩の組合せとを含む単位剤形、

b ) 該キットの使用方法についての取扱説明書、および

c ) 該単位剤形を保持するための少なくとも 1 つの容器を含むキット。

## 【請求項 10】

哺乳動物における糖尿病を治療するための組成物であって、請求項 1 または 2 に記載の化合物の治療有効量を含む組成物。

## 【請求項 11】

哺乳動物における糖尿病を治療するための組成物であって、請求項 4 に記載の混合物の治療有効量を含む組成物。

## 【請求項 12】

哺乳動物における糖尿病性合併症を治療するための組成物であって、請求項 1 または 2 に記載の化合物の治療有効量を含む組成物。

## 【請求項 13】

前記糖尿病性合併症が、腎症、神経障害、網膜症、白内障、心筋症および心臓組織虚血から選択される、請求項 12 に記載の組成物。

## 【請求項 14】

哺乳動物における糖尿病性合併症を治療するための組成物であって、請求項 4 に記載の混合物の治療有効量を含む組成物。

## 【請求項 15】

前記糖尿病性合併症が、腎症、神経障害、網膜症、白内障、心筋症および心臓組織虚血から選択される、請求項 14 に記載の組成物。

## 【請求項 16】

糖尿病組織中のグルタチオン濃度を回復するための組成物であって、請求項 1 または 2 に記載の化合物の治療有効量を含む組成物。

## 【請求項 17】

糖尿病組織中の乳酸およびビルビン酸濃度を調節するための組成物であって、請求項 1

または 2 に記載の化合物を含む組成物。

【請求項 18】

メトホルミン R - ( + ) リボエートを製造するための方法であって、

- a ) 適当なメトホルミン塩からメトホルミンの遊離塩基を新たに調製するステップ、および  
b ) 該新たに調製したメトホルミンの遊離塩基を R - ( + ) リボ酸と約 1 と約 40 の間の温度で反応させるステップを含む方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0021

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0021】

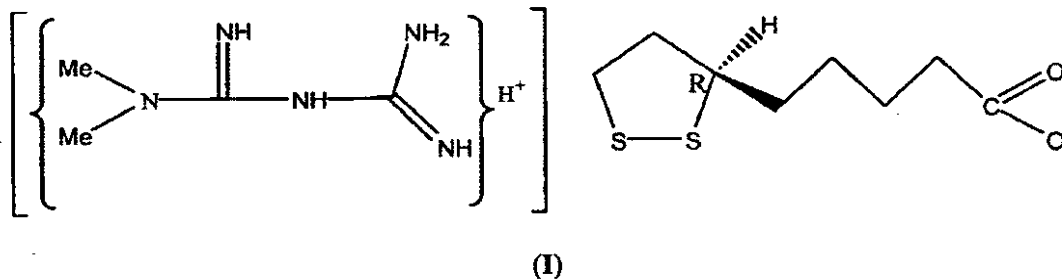
特定の上記実施形態において、該キットは、糖尿病および / または糖尿病の合併症の患者の治療用である。

本発明はまた、以下の項目を提供する。

(項目 1)

メトホルミン R - ( + ) リボエートである式 I の構造を有する化合物、または薬学的に許容できるその溶媒和物もしくは水和物。

【化 2】



(項目 2)

単結晶 X 線回折により測定され、図 1 に描かれている結晶性固体である、請求項 1 に記載の化合物。

(項目 3)

図 2 に描かれている粉末 X 線回折図を示す、請求項 1 に記載の化合物。

(項目 4)

メトホルミンの薬学的に許容できる塩および R - ( + ) リボ酸または薬学的に許容できるその塩を含む混合物。

(項目 5)

メトホルミンの前記薬学的に許容できる塩が、塩酸メトホルミンである、請求項 4 に記載の混合物。

(項目 6)

R - ( + ) リボ酸ナトリウムを含む、請求項 4 に記載の混合物。

(項目 7)

請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物および薬学的に許容できる担体、ビヒクルまたは希釈剤を含む医薬組成物。

(項目 8)

請求項 4 に記載の混合物および薬学的に許容できる担体、ビヒクルまたは希釈剤を含む医薬組成物。

( 項目 9 )

キットであって、

a ) メトホルミン ( R ) - ( + ) - リポエートを含む単位剤形またはメトホルミンの薬学的に許容できる塩および R - ( + ) - リポ酸または薬学的に許容できるその塩の組合せを含む単位剤形、

b ) 該キットの使用方法についての取扱説明書、および

c ) 該単位剤形を保持するための少なくとも 1 つの容器を含むキット。

( 項目 10 )

哺乳動物における糖尿病を治療する方法であって、請求項 1 または 2 に記載の化合物の治療有効量を投与するステップを含む方法。

( 項目 11 )

哺乳動物における糖尿病を治療する方法であって、前記哺乳動物に請求項 4 に記載の混合物の治療有効量を投与するステップを含む方法。

( 項目 12 )

哺乳動物における糖尿病性合併症を治療する方法であって、請求項 1 または 2 に記載の化合物の治療有効量を投与するステップを含む方法。

( 項目 13 )

前記糖尿病性合併症が、腎症、神経障害、網膜症、白内障、心筋症および心臓組織虚血から選択される、請求項 12 に記載の方法。

( 項目 14 )

哺乳動物における糖尿病性合併症を治療する方法であって、前記哺乳動物に請求項 4 に記載の混合物の治療有効量を投与するステップを含む方法。

( 項目 15 )

前記糖尿病性合併症が、腎症、神経障害、網膜症、白内障、心筋症および心臓組織虚血から選択される、請求項 14 に記載の方法。

( 項目 16 )

糖尿病組織中のグルタチオン濃度を回復するための方法であって、請求項 1 または 2 に記載の化合物の治療有効量を投与するステップを含む方法。

( 項目 17 )

糖尿病組織中の乳酸およびビルビン酸濃度を調節するための方法であって、請求項 1 または 2 に記載の化合物を投与するステップを含む方法。

( 項目 18 )

メトホルミン R - ( + ) リポエートを製造するための方法であって、

a ) 適当なメトホルミン塩からメトホルミンの遊離塩基を新たに調製するステップ、および

b ) 該新たに調製したメトホルミンの遊離塩基を R - ( + ) リポ酸と約 1 と約 40 の間の温度で反応させるステップを含む方法。