

【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 07 D 339/04	(2006.01)
C 07 C 279/26	(2006.01)
A 61 K 31/155	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 27/12	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 339/04	
C 07 C 279/26	C S P
A 61 K 31/155	
A 61 P 3/10	
A 61 P 27/12	
A 61 P 13/12	
A 61 P 25/00	
A 61 P 9/10	
A 61 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

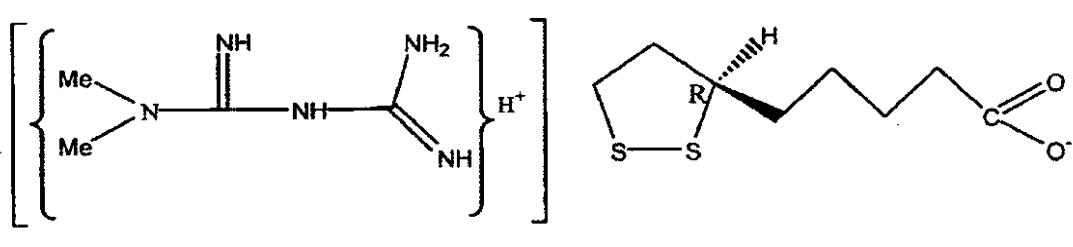
【補正の内容】

【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ピ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。

【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】

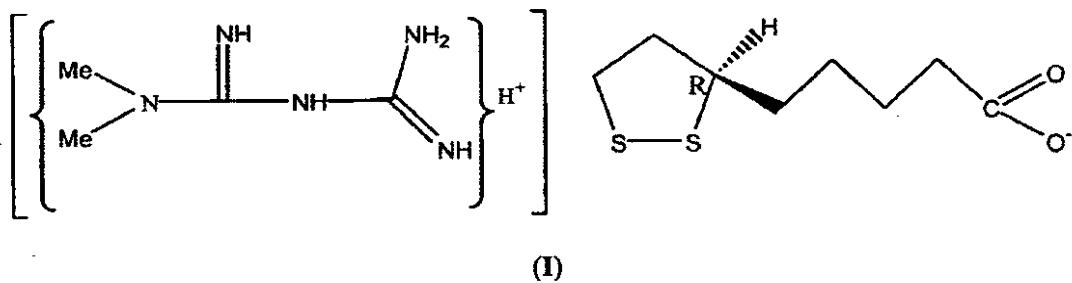
特定の上記実施形態において、該キットは、糖尿病および/または糖尿病の合併症の患者の治療用である。

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】



(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-(+)-リポ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-(+)-リポ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)

キットであつて、

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つて、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つて、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つて、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 1 2 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つて、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 1 4 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つて、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ピルビン酸濃度を調節するための方法であつて、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つて、

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。