

【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2月17日(2011.2.17)

【公開番号】特開2008-239623(P2008-239623A)

【公開日】平成20年10月9日(2008.10.9)

【年通号数】公開・登録公報2008-040

【出願番号】特願2008-68596(P2008-68596)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/12	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
C 1 2 Q	1/02	(2006.01)
C 1 2 Q	1/68	(2006.01)
G 0 1 N	33/15	(2006.01)
G 0 1 N	33/50	(2006.01)
A 6 1 K	31/4985	(2006.01)
C 1 2 N	15/09	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/06	Z N A
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	27/12	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/02	
C 1 2 Q	1/02	
C 1 2 Q	1/68	A
G 0 1 N	33/15	Z
G 0 1 N	33/50	Z
A 6 1 K	31/4985	
C 1 2 N	15/00	A

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月27日(2010.12.27)

【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】

グルカゴン様ペプチド-1 (GLP-1) 分泌促進薬の効果を有するGタンパク質共役型受容体119 (GPR119) アゴニストを含む薬学的組成物を調製する方法であって、該方法は、

(a) 該GPR119アゴニストを、インビトロで哺乳動物腸内分泌細胞と接触させる工程と、

(b) 該GPR119アゴニストが該哺乳動物腸内分泌細胞からのGLP-1分泌を刺激するかどうかを決定する工程であって、該GPR119アゴニストが該哺乳動物腸内分泌細胞からのGLP-1分泌を刺激する能力は、該アゴニストがGLP-1分泌促進薬であることを示す、工程と、

(c) 該GPR119アゴニストを薬学的に許容可能なキャリアとともに薬学的組成物として処方する工程とを含む、方法。

【請求項2】

GLP-1分泌促進薬の効果を有するGPR119アゴニストを含む薬学的組成物を調製する方法であって、該GPR119アゴニストは、インビトロで哺乳動物腸内分泌細胞と接触され、該哺乳動物腸内分泌細胞からのGLP-1分泌を刺激するように決定されており、該GPR119アゴニストが該哺乳動物腸内分泌細胞からのGLP-1分泌を刺激する能力は、該アゴニストがGLP-1分泌促進薬であることを示し、該方法は、該GPR119アゴニストを薬学的に許容可能なキャリアとともに薬学的組成物として処方する工程を含む、方法。

【請求項3】

前記腸内分泌細胞が、GLUTag細胞株の細胞である、請求項1または2の方法。

【請求項4】

GLP-1分泌促進薬の効果を有するGPR119アゴニストを含む薬学的組成物を調製する方法であって、該方法は、

(a) 哺乳動物から得られた生物学的サンプルにおける血中GLP-1レベルを決定する工程であって、該哺乳動物は、該GPR119アゴニストを前もって投与されており、該GPR119アゴニストが該哺乳動物から得られた生物学的サンプルにおける血中GLP-1レベルを増加させる能力は、該アゴニストがGLP-1分泌促進薬であることを示す、工程と、

(b) 該GPR119アゴニストを薬学的に許容可能なキャリアとともに薬学的組成物として処方する工程とを含む、方法。

【請求項5】

GLP-1分泌促進薬の効果を有するGPR119アゴニストを含む薬学的組成物を調製する方法であって、該GPR119アゴニストは、哺乳動物に投与され、該哺乳動物より得られた生物学的サンプル中の血中GLP-1レベルが増加するように決定されており、該方法は、該GPR119アゴニストを薬学的に許容可能なキャリアとともに薬学的組成物として処方する工程を含む、方法。

【請求項6】

前記哺乳動物は非ヒト哺乳動物である、請求項4または5に記載の方法。

【請求項7】

前記哺乳動物はヒトである、請求項4または5に記載の方法。

【請求項8】

前記血中 G L P - 1 レベルは生物活性 G L P - 1 の血中レベルである、請求項 4 ~ 7 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 9】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、ヒト G P R 1 1 9 のアゴニストである、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 10】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、経口で有効である、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 11】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、選択的 G P R 1 1 9 アゴニストである、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 12】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、副腎皮質ホルモン放出因子 - 1 (C R F - 1) 受容体よりも G P R 1 1 9 に対する選択性が少なくとも 1 0 0 倍である、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 13】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、10 μM 未満の E C 5 0 を有する、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 14】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、1 μM 未満の E C 5 0 を有する、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 15】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、100 nM 未満の E C 5 0 を有する、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 16】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、低分子である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 17】

前記組成物は、投薬形態である、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 18】

前記投薬形態は、D P P - I V インヒビターと組み合わされている、請求項 1 7 に記載の方法。

【請求項 19】

前記 D P P - I V インヒビターは、M K - 0 4 3 1 : 3 (R) - アミノ - 1 - [3 - (ト リフルオロメチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] ピラジン - 7 - イル] - 4 - (2 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) ブタン - 1 - オンである、請求項 1 8 に記載の方法。

【請求項 20】

前記 D P P - I V インヒビターは、L A F 2 3 7 : (1 - [[3 - ヒドロキシ - 1 - アダ マンチル) アミノ] アセチル] - 2 - シアノ - (S) - ピロリジンである、請求項 1 8 に記載の方法。

【請求項 21】

前記 D P P - I V インヒビターは、B M S - 4 7 7 1 1 8 : (1 S , 3 S , 5 S) - 2 - [2 (S) - アミノ - 2 - (3 - ヒドロキシアダマンタン - 1 - イル) アセチル] - 2 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 3 - カルボニトリルである、請求項 1 8 に記載の方法。

【請求項 22】

G L P - 1 分泌促進薬を生成する方法であつて、

(a) G P R 1 1 9 アゴニストを哺乳動物腸内分泌細胞または該 G L P - 1 を分泌可能な細胞とインビトロで接触させる工程、

(b) 該 G P R 1 1 9 アゴニストが該哺乳動物腸内分泌細胞または該 G L P - 1 を分泌可能な細胞からの G L P - 1 分泌を刺激するかどうかを決定する工程であって、該 G P R 1 1 9 アゴニストが該哺乳動物腸内分泌細胞または該 G L P - 1 を分泌可能な細胞からの G L P - 1 分泌を刺激する能力は、該 G P R 1 1 9 アゴニストが G L P - 1 分泌促進薬であることを示す、工程と、

(c) 必要に応じて、工程 (b) で決定された該 G P R 1 1 9 アゴニストの構造を決定する工程と、

(d) 該 G L P - 1 分泌促進薬を生成または合成する工程とを含む、方法。

【請求項 2 3】

G L P - 1 分泌促進薬を生成する方法であって、

(a) G P R 1 1 9 アゴニストを前もって投与された哺乳動物から得られたサンプルにおける G L P - 1 レベルを測定することにより、G P R 1 1 9 アゴニストが哺乳動物において G L P - 1 レベルを増加させるかどうかを、決定する工程であって、該 G P R 1 1 9 アゴニストが哺乳動物における G L P - 1 レベルを増加させる能力は、該 G P R 1 1 9 アゴニストが G L P - 1 分泌促進薬であることを示す、工程と、

(b) 必要に応じて、工程 (a) で G L P - 1 分泌促進薬であると決定された該 G P R 1 1 9 アゴニストの構造を決定する工程と、

(c) 該 G L P - 1 分泌促進薬を生成または合成する工程とを含む、方法。

【請求項 2 4】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、ヒト G P R 1 1 9 のアゴニストである、請求項 2 2 または 2 3 に記載の方法。

【請求項 2 5】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、経口で有効である、請求項 2 2 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 2 6】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、選択的 G P R 1 1 9 アゴニストである、請求項 2 2 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 2 7】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、副腎皮質ホルモン放出因子 - 1 受容体よりも G P R 1 1 9 に対する選択性が高い、請求項 2 2 ~ 2 6 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 2 8】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、10 μM 未満の E C 5 0 を有する、請求項 2 2 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 2 9】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、1 μM 未満の E C 5 0 を有する、請求項 2 2 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 0】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、100 nM 未満の E C 5 0 を有する、請求項 2 2 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 1】

前記 G P R 1 1 9 アゴニストは、低分子である、請求項 2 2 ~ 3 0 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 2】

前記哺乳動物が、非ヒト哺乳動物である、請求項 2 3 に記載の方法。

【請求項 3 3】

前記哺乳動物が、マウスである、請求項 2 3 に記載の方法。

【請求項 3 4】

前記哺乳動物が、ヒトである、請求項 2 3 に記載の方法。

【請求項 3 5】

前記 G L P - 1 分泌促進薬を薬学的組成物として処方する工程をさらに含む、請求項 2 2 ~ 3 4 のいずれか一項に記載の方法。