

【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25年4月11日 (2013.4.11)

【公表番号】特表2011-512347(P2011-512347A)

【公表日】平成23年4月21日 (2011.4.21)

【年通号数】公開・登録公報2011-016

【出願番号】特願2010-546398(P2010-546398)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/401 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/7056 (2006.01)

A 6 1 K 36/28 (2006.01)

A 6 1 K 36/18 (2006.01)

A 6 1 K 36/48 (2006.01)

A 6 1 K 36/75 (2006.01)

A 6 1 K 36/42 (2006.01)

A 6 1 K 36/81 (2006.01)

A 6 1 K 36/00 (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 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/197 (2006.01)

A 2 3 L 1/30 (2006.01)

A 2 3 L 2/52 (2006.01)

A 2 3 L 2/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/401

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/46	
A 6 1 K	31/7056	
A 6 1 K	35/78	T
A 6 1 K	35/78	C
A 6 1 K	35/78	J
A 6 1 K	35/78	K
A 6 1 K	35/78	S
A 6 1 K	35/78	R
A 6 1 K	35/78	X
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	27/12	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 K	31/197	
A 2 3 L	1/30	B
A 2 3 L	2/00	F
A 2 3 L	2/00	T

## 【手続補正書】

【提出日】平成24年2月16日(2012.2.16)

## 【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】

糖尿病、肥満、又はメタボリック症候群に関連する疾患を治療する方法に使用する単離イミノ糖酸において、前記イミノ糖酸がジサッカリダーゼ活性を抑制せず、 $\mu\text{M}$ 若しくは  $\text{mM}$ の範囲又はそれより高い  $\text{IC}_{50}$  値を示す、イミノ糖酸。

【請求項 2】

ジベプチジルペプチダーゼ - 4 (DPP - 4) 阻害剤と組み合わせて、糖尿病、肥満、又はメタボリック症候群に関連する疾患を治療する方法に使用する単離イミノ糖酸。

【請求項 3】

ジベプチジルペプチダーゼ - 4 (DPP - 4) 阻害剤と予め混合した、あるいは単一単位容量内でこれを物理的に結合させた、請求項 2 に記載の単離イミノ糖酸。

## 【請求項 4】

ジベプチジルペプチダーゼ - 4 (DPP - 4) 阻害剤と共にパッケージされた、請求項 2 に記載の単離イミノ糖酸。

## 【請求項 5】

前記使用が、イミノ糖酸とジベプチジルペプチダーゼ - 4 (DPP - 4) 阻害剤の共投与を含む、請求項 2 に記載の単離イミノ糖酸。

## 【請求項 6】

ジベプチジルペプチダーゼ - 4 (DPP - 4) 阻害剤と組み合わせたイミノ糖酸を含む組成物。

## 【請求項 7】

糖尿病、肥満、又はメタボリック症候群に関連する疾患を治療する方法に使用する、請求項 6 に記載の組成物。

## 【請求項 8】

前記イミノ糖酸がピペリジン、ピロリジン、ピロリジジン、インドリジジン及びノルトロパンから選択される構造クラスの糖酸である、請求項 1 乃至 7 のいずれか 1 項に記載のイミノ糖酸又は組成物。

## 【請求項 9】

前記イミノ糖酸がポリヒドロキシ化されたものである、請求項 1 乃至 8 のいずれか 1 項に記載のイミノ糖酸又は組成物。

## 【請求項 10】

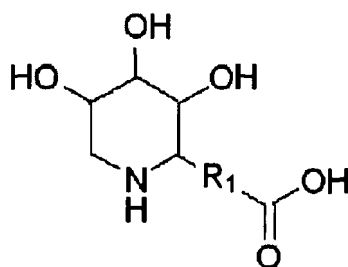
前記イミノ糖酸がピペリジンイミノ糖酸である、請求項 1 乃至 9 のいずれか 1 項に記載のイミノ糖酸又は組成物。

## 【請求項 11】

(a) ピペコリン酸又はヒドロキシピペコリン酸；(b) 環系原子上に少なくとも 3 個の遊離水酸基（又はヒドロキシアルキル基）を有するピペリジン ISA；又は、(c) (a) 又は (b) の N - 酸誘導体；又は、(d) 環系原子上に少なくとも 2 個（例えば、3 個）の遊離水酸基（又はヒドロキシアルキル基）を有する（ポリ）ヒドロキシピペコリン酸；である、請求項 10 に記載のイミノ酸糖又は組成物。

## 【請求項 12】

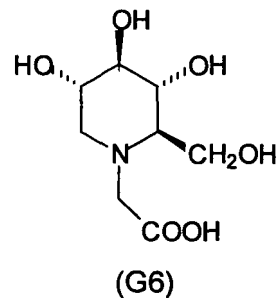
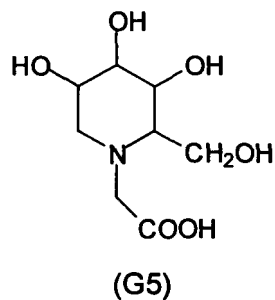
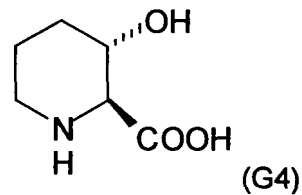
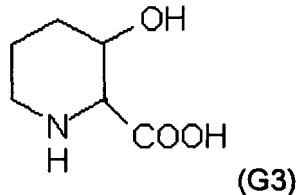
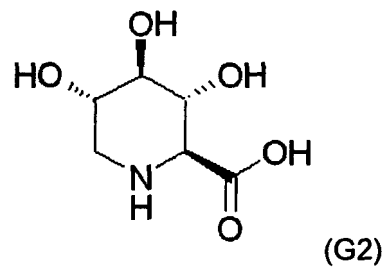
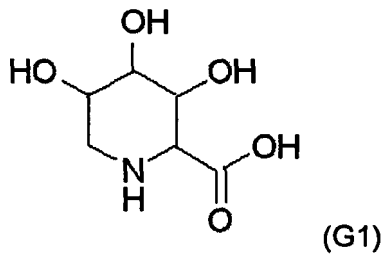
前記イミノ糖又はイミノ酸糖がピペリジンイミノ糖酸が、式 (I) の化合物：



ここで、R<sub>1</sub> は存在しないか又は C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである；カルボキシル基の位置を環炭素から環窒素に移して、式 (I) の化合物の N - 酸類似化合物を生産してもよい；又はアシル（例えば O - アシル）誘導体又は 1 個以上の環水酸基が欠損している脱ヒドロキシル化された類似化合物；であるか、又は薬学的に許容可能なその塩又は誘導体である、請求項 1 乃至 11 に記載のイミノ糖酸又は組成物。

## 【請求項 13】

前記イミノ糖又はイミノ酸糖が、以下に示される構造から選択されたものである：



か、又は ( a ) カルボキシル基の位置が環炭素から環窒素に移っている、上記構造 ( G 1 ) - ( G 4 ) の N - 酸類似化合物 ; ( b ) 上記構造のアシル ( 例えば O - アシル ) 誘導体 ( 又は ( a ) の N - 酸類似化合物 ) ; ( c ) 1 個以上の環水酸基が欠損している、上記構造の脱ヒドロキシル化類似化合物 ( 又は ( a ) 及び ( b ) の N - 酸類似化合物 ) 、である、請求項 1 2 に記載のイミノ糖酸又は組成物。

【請求項 1 4】

高血糖、耐糖能低下、高インスリン血症、糖尿、代謝的酸性血症、白内障、糖尿病性ニューロパチー、糖尿病性腎症、糖尿病性網膜症、黄斑変性、糸球体硬化症、糖尿病性心筋症、インスリン耐性、グルコース代謝の低下、関節炎、高血圧、高脂血症、骨粗鬆症、骨減少症、骨喪失、脆弱骨症候群、急性冠症候群、不妊症、短腸症候群、慢性疲労、摂食障害及び腸運動機能不全を治療する方法に使用する、請求項 1 乃至 1 3 のいずれか 1 項に記載のイミノ糖酸又は組成物。

【請求項 1 5】

2 型糖尿病を治療又は予防する方法に使用する、請求項 1 乃至 1 3 のいずれか 1 項に記載のイミノ糖酸又は組成物。