

【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】令和2年11月26日(2020.11.26)

【公表番号】特表2019-531320(P2019-531320A)

【公表日】令和1年10月31日(2019.10.31)

【年通号数】公開・登録公報2019-044

【出願番号】特願2019-520691(P2019-520691)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|---------|-----------|
| A 6 1 K | 31/166 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/18 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/7034 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/382 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/351 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/7052 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 29/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/16 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 27/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 13/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 27/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 11/00 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/7048 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/7042 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 45/00 | (2006.01) |

【F I】

| | | | | | |
|---------|---------|---|---|---|--|
| A 6 1 K | 31/166 | | | | |
| A 6 1 K | 31/18 | | | | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 | 2 | 1 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 | 1 | 1 | |
| A 6 1 K | 31/7034 | | | | |
| A 6 1 K | 31/382 | | | | |
| A 6 1 K | 31/351 | | | | |
| A 6 1 K | 31/7052 | | | | |
| A 6 1 P | 29/00 | | | | |
| A 6 1 P | 1/16 | | | | |
| A 6 1 P | 27/02 | | | | |
| A 6 1 P | 3/10 | | | | |
| A 6 1 P | 13/12 | | | | |
| A 6 1 P | 25/00 | | | | |
| A 6 1 P | 25/04 | | | | |

| | | |
|---------|---------|-------|
| A 6 1 P | 9/10 | |
| A 6 1 P | 9/10 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 9/04 | |
| A 6 1 P | 9/06 | |
| A 6 1 P | 3/00 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 27/12 | |
| A 6 1 P | 3/04 | |
| A 6 1 P | 11/00 | |
| A 6 1 K | 31/7048 | |
| A 6 1 K | 31/7042 | |
| A 6 1 K | 45/00 | |

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月14日(2020.10.14)

【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】

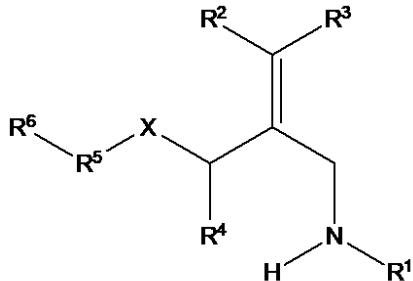
【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記を含む医薬組成物

(a)式(I)のSSAO/VAP-1阻害剤またはその医薬的に許容される塩：

【化1】

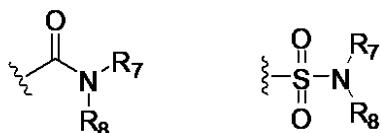


式I

(式中、

R¹およびR⁴は、独立して、水素または置換されていてもよいC₁₋₆-アルキルであり；R²およびR³は、独立して、水素、塩素およびフッ素からなる群から選択されるが；R²とR³は同時に水素ではなく；R⁵は、置換されていてもよいアリーレン基であり；R⁶は、下記基から選択され

【化2】



；

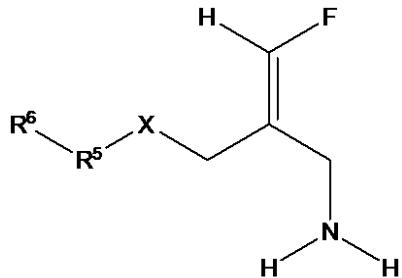
R⁷およびR⁸は、独立して、水素、置換されていてもよいC₁₋₆-アルキルおよび置換されていてもよいC₃₋₇-シクロアルキルからなる群から選択され；Xは、CH₂、酸素、硫黄またはSO₂である)；および

(b) SGLT2阻害剤。

【請求項2】

前記SSAO/VAP-1阻害剤が、式(II)を有する化合物またはその医薬的に許容される塩である、請求項1記載の医薬組成物：

【化3】



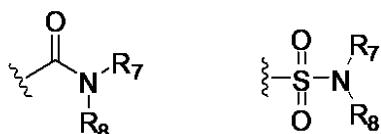
式 II

(式中、

R⁵は、置換されていないフェニレン基、又はアルキル、ハロ、アルコキシ及びハロアルキルから独立して選択される1個以上の基で置換されたフェニレン基であり；

R⁶は、下記の基から選択され

【化4】



； R⁷およびR⁸は、独立して、水素、置換されていてもよいC₁₋₆アルキルおよび置換されていてもよいC₃₋₇シクロアルキルからなる群から選択され；

Xは、酸素である)。

【請求項3】

前記SSAO/VAP-1阻害剤が、下記の化合物からなる群から選択される、請求項1または2記載の医薬組成物

- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)ベンズアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)ベンゼンスルホンアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N,N-ジメチルベンズアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N,N-ジメチルベンゼンスルホンアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-tert-ブチルベンゼンスルホンアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-tert-ブチル-3-フルオロベンズアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-tert-ブチル-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-tert-ブチルベンズアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N,N-ジエチルベンズアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-メチルベンズアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-メチルベンゼンスルホンアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-エチルベンゼンスルホンアミド；
- (E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-イソプロピルベンゼンスルホンアミド；および

(E)-4-(2-(アミノメチル)-3-フルオロアリルオキシ)-N-イソプロピルベンズアミド。

【請求項 4】

前記SGLT2阻害剤が、エンパグリフロジン、ダパグリフロジン、カナグリフロジン、イプラグリフロジン、トホグリフロジン、ルセオグリフロジン、アチグリフロジン、レモグリフロジン、セルグリフロジン、エルツグリフロジンおよびソタグリフロジンの群から選択される、請求項1～3のいずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項 5】

線維性疾患、代謝性疾患、炎症性疾患、眼疾患、神経炎症性疾患または癌を、予防し、進行を減速させ、遅延させまたは治療するための、請求項1～4のいずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記線維性疾患が、囊胞性線維症、間質性肺疾患(特発性肺線維症を含める)、肝線維症、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、アルコール性脂肪肝、アルコール性肝線維症、毒物性脂肪肝および肝硬変、腎線維症、強皮症、放射線線維症ならびに過度の纖維形成が病因に関する他の疾患からなる群から選択される、請求項5記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記代謝性疾患が、真性糖尿病前症、1型真性糖尿病、2型真性糖尿病、真性糖尿病に関連する合併症、過体重、肥満、耐糖能異常(IGT)、空腹時血糖障害(IFG)、高血糖、食後高血糖、インスリン抵抗性、脂肪肝(非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)を含める)、過体重、肥満およびメタボリックシンドロームからなる群から選択される、請求項5記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記代謝性疾患が、下記からなる群：
白内障、ならびに、微小血管症および大血管症(例えば、糖尿病性腎症、糸球体硬化症、糖尿病性網膜症、脈絡膜血管新生、非アルコール性脂肪肝(NAFL)疾患、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、糖尿病性神経障害、糖尿病性疼痛、組織虚血、糖尿病足、糖尿病性潰瘍、動脈硬化症、心筋梗塞、急性冠症候群、不安定狭心症、安定狭心症、脳卒中、末梢動脈閉塞疾患、心筋症、心不全、心血管死、心臓リズム障害および血管再狭窄)から選択される真性糖尿病に関連する合併症である、請求項7記載の医薬組成物。