

【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1月17日 (2013.1.17)

【公表番号】特表2012-509892(P2012-509892A)

【公表日】平成24年4月26日 (2012.4.26)

【年通号数】公開・登録公報2012-017

【出願番号】特願2011-537692(P2011-537692)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/575 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/08

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 37/02

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 K 31/575

【手続補正書】

【提出日】平成24年11月21日 (2012.11.21)

【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】

個人における肥満症又は糖尿病の治療に使用するための、回腸、結腸及び / 又は直腸への経口投与又は直腸内投与に適した医薬組成物であって、

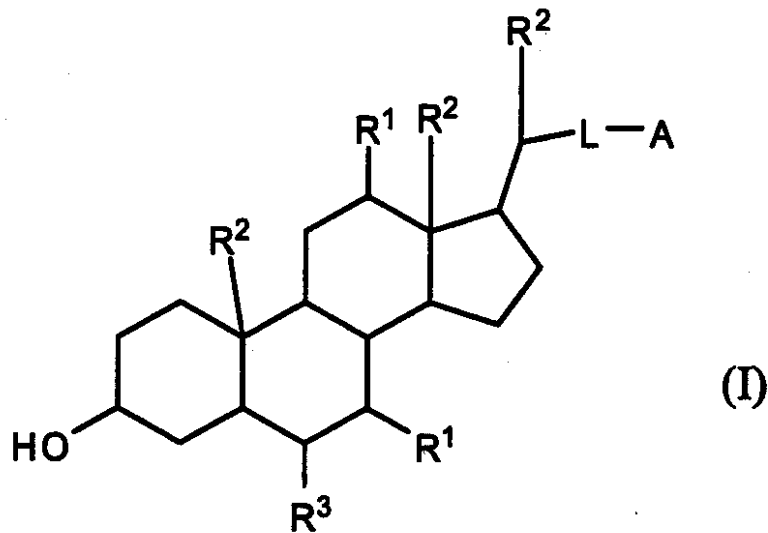
当該医薬組成物が、胆汁酸、胆汁酸塩、胆汁酸模擬物質、胆汁酸塩模擬物質、及び、これらの組合せからなる群から選択される腸内分泌ペプチド分泌促進剤を含有し、

当該医薬組成物は体内吸収が 10 % w t / w t 未満に調製されている、医薬組成物。

【請求項 2】

前記腸内分泌ペプチド分泌促進剤が、次の式 ( I ) で表される化合物であり、

【化 1】



(I)

式中、

それぞれの R<sup>1</sup> は独立した、H、OH、低級アルキル又は低級ヘテロアルキルであり、  
L は、置換若しくは非置換アルキル、又は、置換若しくは非置換ヘテロアルキルであり

それぞれの R<sup>2</sup> は独立した、H、OH、低級アルキル又は低級ヘテロアルキルであり、  
R<sup>3</sup> は、H、OH、O - 低級アルキル、低級アルキル又は低級ヘテロアルキルであり、  
A は、COOR<sup>4</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>4</sup>、又は、OR<sup>5</sup>であり、

ここで、R<sup>4</sup> は、H、アニオン、薬学的に許容可能なカチオン、置換若しくは非置換アルキル、置換若しくは非置換ヘテロアルキル、置換若しくは非置換アリール、置換若しくは非置換ヘテロアリール、又は、アミノ酸であり、

n は、1 ~ 3 であり、

R<sup>5</sup> は低級アルキル又は H である、

請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

治療有効量の DPP - IV 阻害剤を更に含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記腸内分泌ペプチド分泌促進剤が、グルカゴン様ペプチド分泌促進剤である、  
請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記グルカゴン様ペプチド分泌促進剤が、グルカゴン様ペプチド - 1 (GLP - 1) 分泌促進剤、又は、グルカゴン様ペプチド - 2 (GLP - 2) 分泌促進剤である、  
請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記腸内分泌ペプチド分泌促進剤が、膵臓ポリペプチド折り畳みペプチド分泌促進剤である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記膵臓ポリペプチド折り畳みペプチド分泌促進剤が、ペプチド YY (PYY) 分泌促進剤である、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記胆汁酸模擬物質が、TGR - 5 結合類似体、6 - メチル - 2 - オキソ - 4 - チオフェン - 2 - イル - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ピリミジン - 5 - カルボン酸ベンジルエステル、又は、オレアノール酸である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

**【請求項 9】**

粘膜接着剤を更に含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

**【請求項 10】**

前記粘膜接着剤が、メチルセルロース、ポリカルボフィル、ポリビニルピロリドン、カルボキシメチルセルロースナトリウム、及びこれらの組み合わせから選択される、請求項 9 に記載の医薬組成物。

**【請求項 11】**

前記医薬組成物が、坐薬、浣腸溶液、直腸フォーム、直腸ゲル、又は、腸溶経口製剤として調製されている、請求項 1 に記載の医薬組成物。

**【請求項 12】**

前記腸内分泌ペプチド分泌促進剤が、コール酸、デオキシコール酸、グリココール酸、グリコデオキシコール酸、タウロコール酸、タウロジヒドロフシジン酸、タウロデオキシコール酸、コール酸塩、グリココール酸塩、デオキシコール酸塩、タウロコール酸塩、タウロデオキシコール酸塩、ケノデオキシコール酸もしくはその塩、又は、それらの組み合わせである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

**【請求項 13】**

経口投与用の、請求項 1 ～ 12 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 14】**

直腸内投与用の、請求項 1 ～ 12 のいずれか一項に記載の医薬組成物。