

【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3日(2011.2.3)

【公表番号】特表2010-513300(P2010-513300A)
 【公表日】平成22年4月30日(2010.4.30)
 【年通号数】公開・登録公報2010-017
 【出願番号】特願2009-541572(P2009-541572)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)
 C 0 7 C 237/20 (2006.01)
 A 6 1 K 31/165 (2006.01)
 A 6 1 K 31/549 (2006.01)
 A 6 1 P 7/10 (2006.01)
 A 6 1 P 9/12 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00
 C 0 7 C 237/20
 A 6 1 K 31/165
 A 6 1 K 31/549
 A 6 1 P 7/10
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 43/00 1 1 6

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月9日(2010.12.9)

【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】

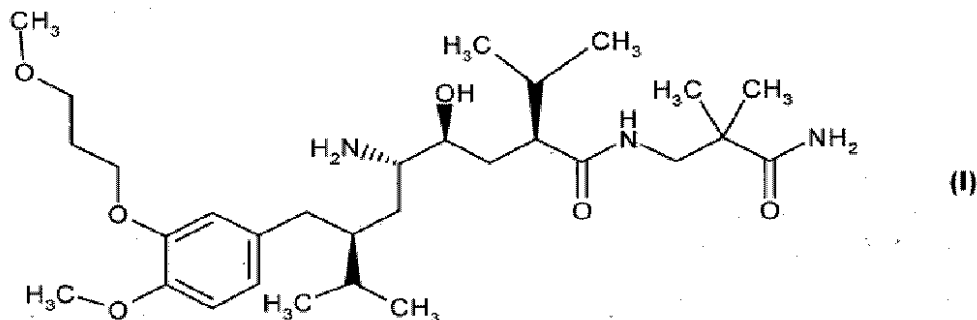
【請求項1】

レニン阻害剤または薬学的に許容されるその塩を有効成分として含む、肥満患者における高血圧の予防、進行遅延または処置のための薬剤。

【請求項2】

レニン阻害剤が、式(1)

【化1】



で示される化合物または薬学的に許容されるその塩である、請求項1に記載の薬剤。

【請求項3】

肥満患者が $>30 \text{ kg/m}^2$ のBMIを有する、請求項1または2に記載の薬剤。

【請求項4】

肥満患者が $>40 \text{ kg/m}^2$ のBMIを有する、請求項3に記載の薬剤。

【請求項5】

利尿薬と組合わせて使用することを特徴とする、請求項1から3のいずれか1項に記載の薬剤。

【請求項6】

利尿薬がヒドロクロロチアジドである、請求項5に記載の薬剤。

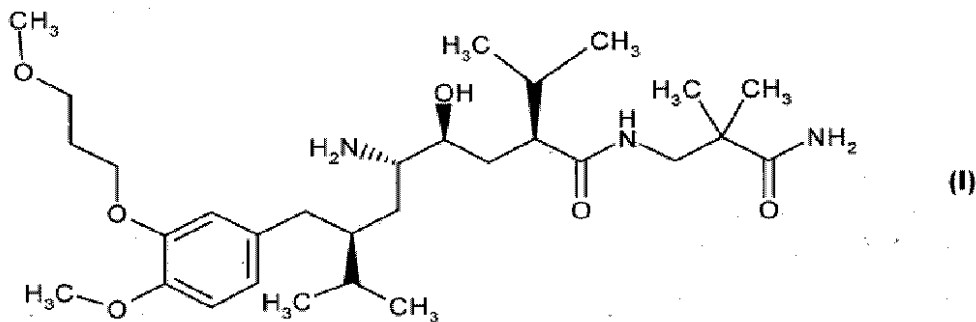
【請求項7】

肥満患者における高血圧の予防、進行遅延または処置用医薬の製造のためのレニン阻害剤または薬学的に許容されるその塩の使用。

【請求項8】

レニン阻害剤が、式(1)

【化2】



で示される化合物または薬学的に許容されるその塩である、請求項7に記載の使用。

【請求項9】

肥満患者が $>30 \text{ kg/m}^2$ のBMIを有する、請求項7または8に記載の使用。

【請求項10】

肥満患者が $>40 \text{ kg/m}^2$ のBMIを有する、請求項9に記載の使用。

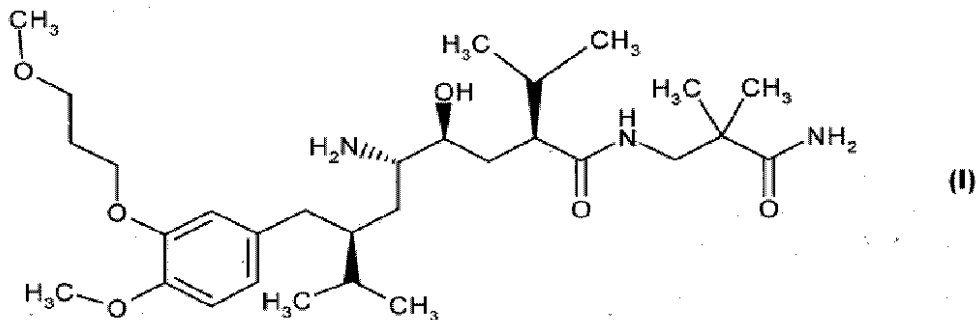
【請求項11】

肥満患者における高血圧の予防、進行遅延または処置用医薬の製造のための利尿薬と組合せたレニン阻害剤または薬学的に許容されるその塩の使用。

【請求項12】

レニン阻害剤が、式(1)

【化3】



で示される化合物または薬学的に許容されるその塩である、請求項11に記載の使用。

【請求項13】

利尿薬がヒドロクロロチアジドである、請求項11または12に記載の使用。

【請求項14】

肥満患者が $>30 \text{ kg/m}^2$ のBMIを有する、請求項11から13のいずれか1項に記載の使用。

【請求項15】

肥満患者が $>40 \text{ kg/m}^2$ のBMIを有する、請求項14に記載の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0003

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0003】

腎臓から放出されたレニンは、循環血液中でアンジオテンシノーゲンを切断し、デカペプチドアンジオテンシンIを形成する。これは、次いで、肺、腎臓および他の器官で、アンジオテンシン変換酵素により切断され、オクタペプチドアンジオテンシンIIを形成する。オクタペプチドは、直接、動脈血管収縮により、および間接的に、副腎からのナトリウムイオン保持ホルモンアルドステロンの放出、その後の細胞外液容積の増加により、血圧を上昇させる。レニンの酵素学的活性の阻害剤は、アンジオテンシンIの形成における減少を生じる。結果として、少量のアンジオテンシンIIが産生される。その活性ペプチドホルモンの濃度の減少は、例えば、レニン阻害剤の抗高血圧効果の直接的な原因である。したがって、レニン阻害剤、またはその塩を、例えば、抗高血圧剤として、または鬱血性心不全および他の高血圧の合併症、例えば、卒中を処置するために使用し得る。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0005

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0005】

肥満である高血圧患者の割合は、ここ数年、徐々に増えてきている。75%の肥満患者が高血圧を有することを考慮すると(しかし、20%未満は、<140/90 mmHgに制御されたBPを有する)、この患者集団の新規抗高血圧処置オプションのための明確な必要性が存在する。しかしながら、現在のガイドラインは、この患者集団の処置のための特定の手引きを提供しない。高血圧は、肥満を患う患者で処置するのをますます困難にしている。共存する危険因子もしくは状態を有する患者で標的血压目標を達成するために、これらの患者では不十分な応答が得られるので、しばしば、特別な処置を必要とする。血圧または他の病的状態が不十分に修飾されると、患者は、重篤な有害事象、例えば、心筋梗塞、卒中および進行性器官損傷のより大きなリスクを伴う。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0053

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0053】

本発明は、同様に、組合わせ剤、例えば、心血管疾患および関連する状態ならびに上記および下記した疾患の処置のために、レニン阻害剤を、単独で、または利尿薬と組合わせて、さらに少なくとも1個の薬剤と、または、各々の場合に、薬学的に許容されるその塩と組合わせて含む医薬的組合わせ剤に関する。