

【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24年5月24日 (2012.5.24)

【公表番号】特表2009-507927(P2009-507927A)

【公表日】平成21年2月26日 (2009.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-008

【出願番号】特願2008-531294(P2008-531294)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/506	(2006.01)
C 0 7 D	401/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/133	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/14	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/22	(2006.01)
A 6 1 K	9/52	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/506	
C 0 7 D	401/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/133	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	1/14	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	9/10	1 0 3

A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 K 9/20
 A 6 1 K 9/48
 A 6 1 K 9/22
 A 6 1 K 9/52
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成24年3月23日(2012.3.23)

【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

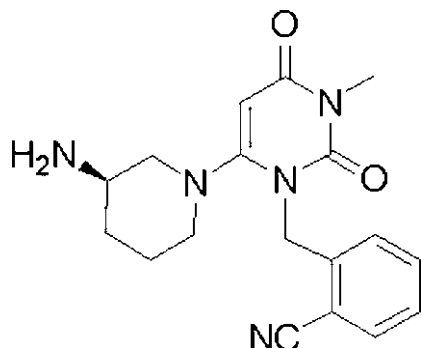
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

単一剤形に製剤される医薬組成物であって、当該単一剤形が 5 m g から 2 5 0 m g の間の式：

【化 1】



を有する化合物 I を含有する、該医薬組成物。

【請求項 2】

当該単一剤形が 1 0 m g から 2 0 0 m g の間の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

当該単一剤形が 1 0 m g から 1 5 0 m g の間の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

当該単一剤形が 1 0 m g から 1 0 0 m g の間の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

当該単一剤形が 1 0 m g の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

当該単一剤形が 1 2 . 5 m g の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

当該単一剤形が 2 0 m g の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

当該単一剤形が 2 5 m g の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

当該単一剤形が 5 0 m g の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

当該単一剤形が 75 mg の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

当該単一剤形が 100 mg の化合物 I を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

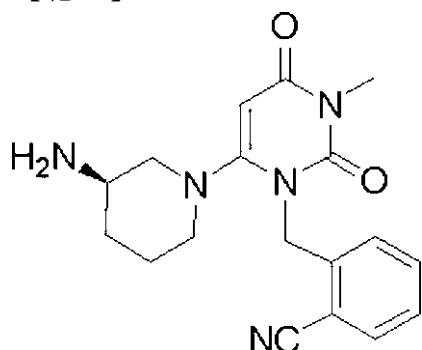
【請求項 12】

当該単一剤形が化合物 I 以外の一つ以上の抗糖尿病性化合物をさらに含有する、請求項 1 ～ 11 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 13】

単一剤形に製剤される医薬組成物であって、当該単一剤形が式：

【化 2】



を有する化合物 I および化合物 I 以外の一つ以上の抗糖尿病性化合物を包含する、該医薬組成物。

【請求項 14】

当該単一剤形が、インスリンシグナル経路モジュレーター、無調節な肝臓でのグルコースの生産に影響する化合物、インスリン感受性エンハンサー、およびインスリン分泌エンハンサーから成る群より選ばれる一つ以上の抗糖尿病性化合物を含有する、請求項 1 ～ 13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 15】

当該単一剤形が、タンパク質チロシンホスファターゼ阻害剤、グルタミン-フルクトース-6-ホスフェート アミドトランスフェラーゼ阻害剤、グルコース-6-ホスファターゼ阻害剤、フルクトース-1, 6-ビスホスファターゼ阻害剤、グリコーゲンホスホリラーゼ阻害剤、グルカゴン受容体拮抗薬、ホスホエノールピルビン酸カルボキシキナーゼ阻害剤、ピルビン酸デヒドロゲナーゼキナーゼ阻害剤、アルファ-グルコシダーゼ阻害剤、胃内容排出の阻害剤、グルコキナーゼ活性化剤、GLP-1 受容体作動薬、GLP-2 受容体拮抗薬、UCP モジュレーター、RXR モジュレーター、GSK-3 阻害剤、PPAR モジュレーター、インスリン、および α_2 -アドレナリン拮抗薬から成る群より選ばれる一つ以上の抗糖尿病性化合物を包含する、請求項 1 ～ 13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 16】

当該単一剤形が、GSK-3 阻害剤、レチノイド X 受容体作動薬、ベータ-3 AR 作動薬、UCP モジュレーター、抗糖尿病性チアゾリジンジオン、非グリタゾン型 PPAR ガンマ作動薬、デュアル PPAR ガンマ/PPAR アルファ作動薬、抗糖尿病性バナジウム含有化合物およびビグアニドから成る群より選ばれる一つ以上の抗糖尿病性化合物を含有する、請求項 1 ～ 13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 17】

該単一剤形が、そのどのような医薬上許容され得る塩も含む、

(S) - ((3, 4-ジヒドロ-2-(フェニル-メチル)-2H-1-ベンゾピラン-6-イル)メチル-チアゾリジン-2, 4-ジオン、
5-{ [4-(3-(5-メチル-2-フェニル-4-オキサゾリル)-1-オキソ-プロピル)-フェニル]-メチル }-チアゾリジン-2, 4-ジオン、
5-{ [4-(1-メチル-シクロヘキシル-メトキシ)-フェニル]メチル }-チアゾ

リジン-2, 4-ジオン、
 5- { [4- (2- (1-インドリル) エトキシ) フェニル] メチル} -チアゾリジン-2, 4-ジオン、
 5- {4- [2- (5-メチル-2-フェニル-4-オキサゾリル) -エトキシ] ベンジル} -チアゾリジン-2, 4-ジオン、
 5- (2-ナフチルスルホニル) -チアゾリジン-2, 4-ジオン、ビス {4- [(2, 4-ジオキソ-5-チアゾリジニル) -メチル] フェニル} メタン、
 5- {4- [2- (5-メチル-2-フェニル-4-オキサゾリル) -2-ヒドロキシエトキシ] -ベンジル} -チアゾリジン-2, 4-ジオン、
 5- [4- (1-フェニル-1-シクロプロパンカルボニルアミノ) -ベンジル] -チアゾリジン-2, 4-ジオン、
 5- { [4- (2- (2, 3-ジヒドロインドール-1-イル) エトキシ) フェニル] メチル} -チアゾリジン-2, 4-ジオン、
 5- [3- (4-クロロフェニル)] -2-プロピニル] -5-フェニルスルホニル) チアゾリジン-2, 4-ジオン、
 5- [3- (4-クロロフェニル)] -2-プロピニル] -5- (4-フルオロフェニルスルホニル) チアゾリジン-2, 4-ジオン、
 5- { [4- (2- (メチル-2-ピリジニル-アミノ) -エトキシ) フェニル] メチル} -チアゾリジン-2, 4-ジオン、
 5- { [2- (2-ナフチル) -ベンズオキサゾール-5-イル] -メチル} チアゾリジン-2, 4-ジオンおよび
 5- (2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル) -2-メトキシー-N- (4-トリフルオロメチル-ベンジル) ベンズアミドから成る群より選ばれる一つ以上の抗糖尿病性化合物を含有する、請求項1~13のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項18】

当該単一剤形がそのどのような医薬上許容され得る塩も含むメトホルミンを含有する、請求項1~13のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項19】

当該単一剤形が、スルホニルウレア誘導体を含有する、請求項1~13のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項20】

当該単一剤形が、そのどのような医薬上許容され得る塩も含む、グリソキセピド、グリブリド、グリベンクラミド、アセトヘキサミド、クロロプロバミド、グリボルヌリド、トルブタミド、トラザミド、グリピザイド、カルブタミド、グリクイドン、グリヘキサミド、フェンブタミド、トルシクラミド、グリメピリドおよびグリクラジドから成る群より選ばれる一つ以上の抗糖尿病性化合物を含有する、請求項1~13のいずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項21】

当該単一剤形が、インクレチンホルモンもしくはその模倣体、ペーター細胞イミダゾリン受容体拮抗薬、および速効型インスリン分泌促進剤から成る群より選ばれる一つ以上の抗糖尿病性化合物を含有する、請求項1~13のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項22】

当該単一剤形がインスリンを含有する、請求項1~13のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項23】

当該単一剤形が一つ以上のGLP-1作動薬を含有する、請求項1~13のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項24】

当該単一剤形が一つ以上のGLP-2作動薬を含有する、請求項1~13のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 25】

当該単一剤形がエクセナチドを含む、請求項 1～13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 26】

当該単一剤形が、そのどのような医薬上許容され得る塩も含む、レパグリニド、ミチグリニド、およびナテグリニドから成る群より選ばれる一つ以上の抗糖尿病性化合物を含有する、請求項 1～13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 27】

当該単一剤形が一つ以上のアルファーグルコシダーゼ阻害剤を含有する、請求項 1～13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 28】

当該単一剤形が、そのどのような医薬上許容され得る塩も含む、アカルボース、ボグリボースおよびミグリトールから成る群より選ばれる一つ以上の抗糖尿病性化合物を含有する、請求項 1～13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 29】

当該単一剤形がそのどのような医薬上許容され得る塩も含むロシグリタゾンを含む、請求項 1～13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 30】

当該単一剤形がそのどのような医薬上許容され得る塩も含むピオグリタゾンを含む、請求項 1～13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 31】

当該単一剤形がそのどのような医薬上許容され得る塩も含む、メトホルミンおよびピオグリタゾンを含む、請求項 1～13 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 32】

ピオグリタゾンがピオグリタゾン HCl を包含する、請求項 30 および 31 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 33】

当該単一剤形が、経口、非経口、腹腔内、静脈内、動脈内、経皮、舌下、筋肉内、直腸内、口腔内、鼻腔内、リポソーム、吸入経路、膈内、眼内、局所送達経路、皮下、脂肪内、関節内、および鞘内から成る群より選ばれる経路による投与に適合している、請求項 1～32 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 34】

当該単一剤形が経口投与に適合した、請求項 1～32 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 35】

当該単一剤形が経口投与に適合した固形製剤である、請求項 1～32 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 36】

当該単一剤形が経口投与に適合した、錠剤またはカプセルである、請求項 1～32 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 37】

当該単一剤形が経口投与に適合した徐放性製剤を包含する、請求項 1～32 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 38】

化合物 I が医薬組成物中に遊離の塩基として存在する、請求項 1～37 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 39】

化合物 I が医薬上許容され得る塩として医薬組成物中に存在する、請求項 1～37 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 40】

化合物 I が安息香酸塩として医薬組成物中に存在する、請求項 1 ～ 37 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 41】

化合物 I がトルエンスルホン酸塩として医薬組成物中に存在する、請求項 1 ～ 37 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 42】

化合物 I が塩酸塩として医薬組成物中に存在する、請求項 1 ～ 37 のいずれか一つに記載の医薬組成物。

【請求項 43】

D P P - I V に介在される病態の治療のための医薬品の製造における、化合物 I 以外の 1 つ以上の抗糖尿病性化合物と組み合わせた請求項 1 ～ 42 のいずれか一つに記載の医薬組成物の使用。

【請求項 44】

I 型糖尿病の治療のための医薬品の製造における、請求項 1 ～ 42 のいずれか 1 項記載の医薬組成物の使用。

【請求項 45】

I I 型糖尿病の治療のための医薬品の製造における、請求項 1 ～ 42 のいずれか 1 項記載の医薬組成物の使用。

【請求項 46】

前糖尿病 (p r e d i a b e t i c) の治療のための医薬品の製造における、請求項 1 ～ 42 のいずれか 1 項記載の医薬組成物の使用。

【請求項 47】

複数回分の請求項 1 ～ 42 のいずれか一つに記載の医薬組成物、ならびに医薬組成物が投与されるべき病態の表示、医薬組成物の保管情報、用量情報および医薬組成物の投与方法に関する指示から成る群より選ばれる一つ以上の情報の形態を包含する指示を含む、キット。

【請求項 48】

複数回分の請求項 1 ～ 42 のいずれか一つに記載の医薬組成物、および包装材料を含む、製造品。

【請求項 49】

包装材料が複数回分の医薬組成物を保管する容器を包含する、請求項 48 に記載の製造品。

【請求項 50】

容器が、化合物が投与されるべき病状、保管情報、用量情報および／または組成物の投与方法に関する指示から成る群の一つ以上の要素を指示するラベルを含む、請求項 49 に記載の製造品。

【請求項 51】

I 型または I I 型糖尿病を治療するための経口投与用医薬組成物の製造における 2 - [[6 - [(3 R) - 3 - アミノ - 1 - ピペリジニル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 3 - メチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 (2 H) - ピリミジニル] メチル] - ベンゾニトリルまたは医薬上許容され得るその塩の使用であって、該医薬組成物が、1 日用量が 5 m g から 2 5 0 m g の間であるように 2 - [[6 - [(3 R) - 3 - アミノ - 1 - ピペリジニル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 3 - メチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 (2 H) - ピリミジニル] メチル] - ベンゾニトリルまたは医薬上許容され得るその塩を治療的有效量含有する、使用。