

【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11月15日 (2012.11.15)

【公開番号】特開2012-6970(P2012-6970A)

【公開日】平成24年1月12日 (2012.1.12)

【年通号数】公開・登録公報2012-002

【出願番号】特願2011-201117(P2011-201117)

【国際特許分類】

C 0 7 D 223/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 0 7 D 491/048 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 223/16 Z

A 6 1 K 31/55

C 0 7 D 491/048

C 0 7 D 409/04

C 0 7 D 403/04

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/32

【手続補正書】

【提出日】平成24年9月14日 (2012.9.14)

【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

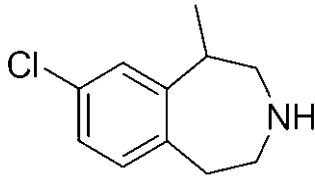
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式：

【化 1】

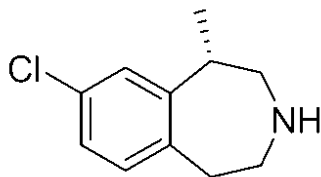


を有する、8 - クロロ - 1 - メチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物。

【請求項 2】

以下の式：

【化 2】



を有する、(S) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物。

【請求項 3】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、治療によるヒトまたは動物の身体の処置の方法における使用のための組成物。

【請求項 4】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、哺乳動物の肥満の予防または処置のための組成物。

【請求項 5】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、哺乳動物の食物摂取を減少させるための組成物。

【請求項 6】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、哺乳動物において満腹を誘導するための組成物。

【請求項 7】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、哺乳動物において体重増加をコントロールするための組成物。

【請求項 8】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、哺乳動物における体重減少のための組成物。

【請求項 9】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、哺乳動物における体重維持のための組成物。

【請求項 10】

前記体重の維持は、体重減少後の体重維持を含む、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 1 1】

前記哺乳動物がヒトである、請求項 4 ～ 1 0 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 2】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、 $30 \text{ kg} / \text{m}^2$ より大きな肥満度指数 (BMI) を有するヒトの処置方法において使用するための組成物。

【請求項 1 3】

薬学的に有効な量の請求項 1 または 2 に記載の化合物を含む、 $25 \sim 30 \text{ kg} / \text{m}^2$ の肥満度指数 (BMI) を有するヒトの処置方法において使用するための組成物。

【請求項 1 4】

前記ヒトが、睡眠時無呼吸症、高血圧、心臓血管疾患、および糖尿病から選択される少なくとも 1 つの体重関連状態を有する、請求項 1 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 5】

前記ヒトが、高血圧、心臓血管疾患、および糖尿病から選択される少なくとも 1 つの体重関連状態を有する、請求項 1 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 6】

前記ヒトが、睡眠時無呼吸症を有する、請求項 1 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 7】

前記ヒトが、高血圧を有する、請求項 1 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 8】

前記ヒトが、心臓血管疾患を有する、請求項 1 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 9】

前記ヒトが、糖尿病を有する、請求項 1 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 0】

前記ヒトが、男性であれば 25% より大きな体脂肪含量、および女性であれば 30% より大きな体脂肪含量を有する、請求項 1 1 ～ 1 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 1】

前記処置が、前記ヒトに、身体的活動を増加させるようにアドバイスすることを含む、請求項 1 1 ～ 2 0 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 2】

前記処置が、前記ヒトに、食事の脂肪含量を減少させるようにアドバイスすることを含む、請求項 1 1 ～ 2 1 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 3】

前記処置が、前記ヒトに、より少ないカロリーを消費するようにアドバイスすることを含む、請求項 1 1 ～ 2 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 4】

哺乳動物の肥満の予防または処置のための医薬の製造のための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の、使用。

【請求項 2 5】

哺乳動物の食物摂取を減少させるための医薬の製造のための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の、使用。

【請求項 2 6】

哺乳動物における満腹を誘導するための医薬の製造のための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の、使用。

【請求項 2 7】

哺乳動物の体重増加をコントロールするための医薬の製造のための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の、使用。

【請求項 2 8】

哺乳動物における体重減少のための医薬の製造のための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の、使用。

【請求項 29】

哺乳動物における体重維持のための医薬の製造のための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の、使用。

【請求項 30】

前記体重の維持は、体重減少後の体重の維持を含む、請求項 29 に記載の使用。

【請求項 31】

前記哺乳動物はヒトである、請求項 24 ～ 30 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 32】

30 kg / m² より大きな肥満度指数 (BMI) を有する哺乳動物の処置のための医薬の製造のための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の、使用。

【請求項 33】

25 ～ 30 kg / m² の肥満度指数 (BMI) を有する哺乳動物の処置のための医薬の製造のための、請求項 1 または 2 に記載の化合物の、使用。

【請求項 34】

前記ヒトが、睡眠時無呼吸症、高血圧、心臓血管疾患、および糖尿病から選択される少なくとも 1 つの体重関連状態を有する、請求項 31 ～ 33 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 35】

前記ヒトが、高血圧、心臓血管疾患、および糖尿病から選択される少なくとも 1 つの体重関連状態を有する、請求項 31 ～ 33 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 36】

前記ヒトが、睡眠時無呼吸症を有する、請求項 31 ～ 33 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 37】

前記ヒトが、高血圧を有する、請求項 31 ～ 33 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 38】

前記ヒトが、心臓血管疾患を有する、請求項 31 ～ 33 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 39】

前記ヒトが、糖尿病を有する、請求項 31 ～ 33 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 40】

前記ヒトが、男性であれば 25 % より大きな体脂肪含量、および女性であれば 30 % より大きな体脂肪含量を有する、請求項 31 ～ 39 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 41】

前記処置が、前記ヒトに、身体的活動を増加させるようにアドバイスすることを含む、請求項 31 ～ 40 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 42】

前記処置が、前記ヒトに、食事の脂肪含量を減少させるようにアドバイスすることを含む、請求項 31 ～ 41 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 43】

前記処置が、前記ヒトに、より少ないカロリーを消費するようにアドバイスすることを含む、請求項 31 ～ 42 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 44】

請求項 1 または 2 に記載の化合物と、薬学的に受容可能なキャリアまたは賦形剤とを含む、組成物。

【請求項 45】

前記組成物が薬学的組成物である、請求項 44 に記載の組成物。

【請求項 46】

請求項 1 または 2 に記載の化合物と、薬学的に受容可能なキャリアまたは賦形剤とを組み合わせることを含む、組成物の調製方法。

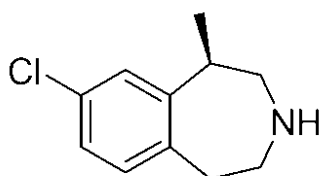
【請求項 47】

前記組成物が薬学的組成物である、請求項 46 に記載の方法。

【請求項 48】

哺乳動物における体重減少のための医薬の製造のための、以下の式：

【化 3】

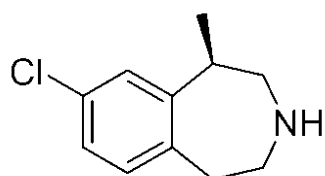


を有する (R) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物の、使用。

【請求項 4 9】

哺乳動物における体重維持のための医薬の製造のための、以下の式：

【化 4】



を有する (R) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物の、使用。

【請求項 5 0】

前記体重の維持が、体重減少後の体重の維持を含む、請求項 4 9 に記載の使用。

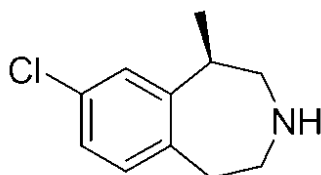
【請求項 5 1】

前記哺乳動物がヒトである、請求項 4 8 ~ 5 0 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5 2】

3 0 k g / m ² より大きな肥満度指数 (B M I) を有するヒトの処置のための医薬の製造のための、以下の式：

【化 5】

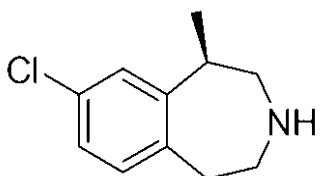


を有する (R) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物の、使用。

【請求項 5 3】

2 5 ~ 3 0 k g / m ² の肥満度指数 (B M I) を有するヒトの処置のための医薬の製造のための、以下の式：

【化 6】



を有する (R) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物の、使用。

【請求項 5 4】

前記ヒトが、睡眠時無呼吸症、高血圧、心臓血管疾患、および糖尿病から選択される少なくとも 1 つの体重関連状態を有する、請求項 5 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5 5】

前記ヒトが、高血圧、心臓血管疾患、および糖尿病から選択される少なくとも 1 つの体重関連状態を有する、請求項 5 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5 6】

前記ヒトが、睡眠時無呼吸症を有する、請求項 5 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5 7】

前記ヒトが、高血圧を有する、請求項 5 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5 8】

前記ヒトが、心臓血管疾患を有する、請求項 5 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5 9】

前記ヒトが、糖尿病を有する、請求項 5 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 6 0】

前記ヒトが、男性であれば 2 5 % より大きな体脂肪含量、および女性であれば 3 0 % より大きな体脂肪含量を有する、請求項 5 1 ~ 5 9 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 6 1】

前記処置が、前記ヒトに、身体的活動を増加させるようにアドバイスすることを含む、請求項 5 1 ~ 6 0 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 6 2】

前記処置が、前記ヒトに、食事の脂肪含量を減少させるようにアドバイスすることを含む、請求項 5 1 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の使用。

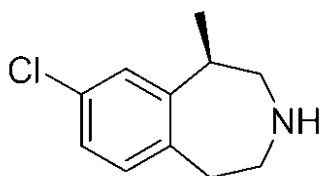
【請求項 6 3】

前記処置が、前記ヒトに、より少ないカロリーを消費するようにアドバイスすることを含む、請求項 5 1 ~ 6 2 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 6 4】

哺乳動物における体重減少のための組成物であって、薬学的に有効な量の以下の式：

【化 7】

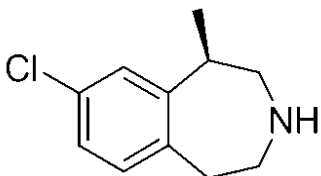


を有する (R) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物を含む、組成物。

【請求項 6 5】

哺乳動物における体重維持のための組成物であって、薬学的に有効な量の以下の式：

【化 8】



を有する (R) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物を含む、組成物。

【請求項 6 6】

前記体重の維持が、体重減少後の体重の維持を含む、請求項 6 5 に記載の組成物。

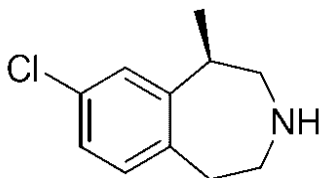
【請求項 6 7】

前記哺乳動物がヒトである、請求項 6 4 ~ 6 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 6 8】

30 kg / m² より大きな肥満度指数 (BMI) を有するヒトの処置のための、薬学的に有効な量の以下の式：

【化 9】

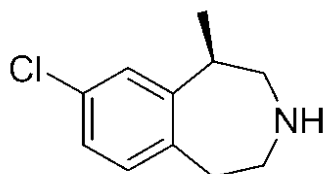


を有する (R) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物を含む、組成物。

【請求項 6 9】

25 ~ 30 kg / m² の肥満度指数 (BMI) を有するヒトの処置のための、薬学的に有効な量の以下の式：

【化 10】



を有する (R) - 8 - クロロ - 1 - メチル - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピンから選択される化合物、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物を含む、組成物。

【請求項 7 0】

前記ヒトが、睡眠時無呼吸症、高血圧、心臓血管疾患、および糖尿病から選択される少なくとも 1 つの体重関連状態を有する、請求項 6 7 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 7 1】

前記ヒトが、高血圧、心臓血管疾患、および糖尿病から選択される少なくとも 1 つの体重関連状態を有する、請求項 6 7 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 7 2】

前記ヒトが、睡眠時無呼吸症を有する、請求項 6 7 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 7 3】

前記ヒトが、高血圧を有する、請求項 6 7 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 7 4】

前記ヒトが、心臓血管疾患を有する、請求項 6 7 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 7 5】

前記ヒトが、糖尿病を有する、請求項 6 7 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 7 6】

前記ヒトが、男性であれば 25 % より大きな体脂肪含量、および女性であれば 30 % より

大きな体脂肪含量を有する、請求項 67～75 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 77】

前記処置が、前記ヒトに、身体的活動を増加させるようにアドバイスすることを含む、請求項 67～76 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 78】

前記処置が、前記ヒトに、食事の脂肪含量を減少させるようにアドバイスすることを含む、請求項 67～77 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 79】

前記処置が、前記ヒトに、より少ないカロリーを消費するようにアドバイスすることを含む、請求項 67～78 のいずれか 1 項に記載の組成物。