

【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26年10月16日(2014.10.16)

【公表番号】特表2013-536859(P2013-536859A)

【公表日】平成25年9月26日(2013.9.26)

【年通号数】公開・登録公報2013-052

【出願番号】特願2013-527264(P2013-527264)

【国際特許分類】

C 07 D 223/16 (2006.01)
 A 61 K 31/55 (2006.01)
 A 61 P 3/10 (2006.01)
 A 61 K 45/00 (2006.01)
 A 61 K 31/155 (2006.01)
 A 61 K 31/137 (2006.01)
 A 61 P 3/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 223/16 C S P B
 A 61 K 31/55
 A 61 P 3/10
 A 61 K 45/00
 A 61 K 31/155
 A 61 K 31/137
 A 61 P 3/04

【手続補正書】

【提出日】平成26年8月29日(2014.8.29)

【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】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンヘミエジシル酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンリン酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンクエン酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンヘミシュウ酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンコハク酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンオキソグルタル酸塩；ならびに

その薬学的に許容可能な塩、溶媒和物および水和物から選択される塩。

【請求項2】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンヘミエジシル酸塩である、請求項1に記載の塩。

【請求項 3】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンリン酸塩である、請求項1に記載の塩。

【請求項 4】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンクエン酸塩半水和物である、請求項1に記載の塩。

【請求項 5】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンヘミシュウ酸塩である、請求項1に記載の塩。

【請求項 6】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンコハク酸塩である、請求項1に記載の塩。

【請求項 7】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンオキソグルタル酸塩である、請求項1に記載の塩。

【請求項 8】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンオキソグルタル酸塩溶媒和物である、請求項1に記載の塩。

【請求項 9】

請求項1から8のいずれか一項に記載の塩および薬学的に許容可能な担体を含む薬学的組成物。

【請求項 10】

請求項1から8のいずれか一項に記載の塩および薬学的に許容可能な担体を混和することを含む、薬学的組成物を調製するための方法。

【請求項 11】

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンの薬学的に許容可能な塩、ならびにその薬学的に許容可能な溶媒和物および水和物から選択される治療有効量の塩を含む剤形であって、非吸湿性剤形である剤形。

【請求項 12】

前記塩が、

約90%RHおよび約25で約2時間後に約2重量%未満の水；
約90%RHおよび約25で約2時間後に約1重量%未満の水；
約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.6重量%未満の水；
約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.5重量%未満の水；
約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.4重量%未満の水；
約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.3重量%未満の水；
約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.2重量%未満の水；または
約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.1重量%未満の水
を吸収する、請求項11に記載の剤形。

【請求項 13】

治療有効量の請求項1から8のいずれか一項に記載の塩を含む剤形。

【請求項 14】

個体において体重管理のための医薬の製造における、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩の使用。

【請求項 15】

前記体重管理が、体重減少、体重減少の維持、食物消費量の減少、食事に関連する満腹の増加、食事前の空腹感の減少、および食事間の食物摂取量の減少の1つまたは複数を含む、請求項14に記載の使用。

【請求項 16】

前記医薬が、規定食および運動の補助として使用される、請求項14または15に記載

の使用。

【請求項 17】

体重管理を必要とする前記個体が、

最初のボディマス指数 $30 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する肥満患者；

少なくとも 1 つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 $27 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する過体重の患者；ならびに

少なくとも 1 つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 $27 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する過体重の患者であって、該体重関連共存状態が、高血圧症、脂質異常症、心臓血管疾患、耐糖能低下、および睡眠時無呼吸から選択される、過体重の患者

から選択される、請求項 14 から 16 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 18】

前記医薬が、第二の抗肥満剤と組み合わせて使用される、請求項 14 から 17 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 19】

前記医薬が、抗糖尿病剤と組み合わせて使用され、該抗糖尿病剤が、メトホルミンである、請求項 14 から 18 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 20】

治療によるヒトまたは動物の体の処置方法において使用するための組成物であって、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の塩、または請求項 9 に記載の薬学的組成物、または請求項 11 から 13 のいずれか一項に記載の剤形を含む組成物。

【請求項 21】

体重管理の方法において使用するための組成物であって、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の塩、または請求項 9 に記載の薬学的組成物、または請求項 11 から 13 のいずれか一項に記載の剤形を含む組成物。

【請求項 22】

体重管理の方法において使用するための組成物であって、

該体重管理が、体重減少、体重減少の維持、食物消費量の減少、食事に関する満腹の増加、食事前の空腹感の減少、および食事間の食物摂取量の減少の 1 つまたは複数を含み、該組成物は、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の塩、または請求項 9 に記載の薬学的組成物を含む組成物。

【請求項 23】

体重管理のための規定食および運動の補助として使用するための組成物であって、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の塩、または請求項 9 に記載の薬学的組成物、または請求項 11 から 13 のいずれか一項に記載の剤形を含む組成物。

【請求項 24】

体重管理の方法において使用するための組成物であって、

体重管理を必要とする前記個体が、

最初のボディマス指数 $30 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する肥満患者；

少なくとも 1 つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 $27 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する過体重の患者；ならびに

少なくとも 1 つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 $27 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する過体重の患者であって、該体重関連共存状態が、高血圧症、脂質異常症、心臓血管疾患、耐糖能低下、および睡眠時無呼吸から選択される、過体重の患者

から選択され、前記組成物は、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の塩、または請求項 9 に記載の薬学的組成物、または請求項 11 から 13 のいずれか一項に記載の剤形を含む組成物。

【請求項 25】

第二の抗肥満剤と組み合わせて、体重管理の方法において使用するための組成物であって、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の塩、または請求項 9 に記載の薬学的組成物、または請求項 11 から 13 のいずれか一項に記載の剤形を含む組成物。

【請求項 26】

メトホルミンである抗糖尿病剤と組み合わせて体重管理の方法において使用するための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩、または請求項9に記載の薬学的組成物、または請求項11から13のいずれか一項に記載の剤形を含む組成物。

【請求項 27】

肥満症を処置する方法において使用するための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩、または請求項9に記載の薬学的組成物を含む組成物。

【請求項 28】

食物摂取量を減少させる方法において使用するための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩、または請求項9に記載の薬学的組成物を含む組成物。

【請求項 29】

満腹を誘発する方法において使用するための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩、または請求項9に記載の薬学的組成物を含む組成物。

【請求項 30】

5-HT_{2c}受容体活性と関連する障害を処置する方法において使用するための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩、または請求項9に記載の薬学的組成物を含む組成物。

【請求項 31】

肥満症を処置する方法において使用するための医薬の製造のための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩を含む組成物。

【請求項 32】

食物摂取量を減少させる方法において使用するための医薬の製造のための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩を含む組成物。

【請求項 33】

満腹を誘発する方法において使用するための医薬の製造のための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩を含む組成物。

【請求項 34】

5-HT_{2c}受容体活性と関連する障害を処置する方法において使用するための医薬の製造のための組成物であって、請求項1から8のいずれか一項に記載の塩を含む組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0037

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0037】

本発明の一態様は、治療によるヒトまたは動物の体の処置方法において使用するための、本発明の塩および薬学的組成物に関する。

一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目1)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンヘミエジシル酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンリン酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンクエン酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンヘミシュウ酸塩；

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンコハク酸塩；および

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンオキソグルタル酸塩；ならびに

その薬学的に許容可能な塩、溶媒和物および水和物から選択される塩。

(項目2)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンヘミエジシル酸塩である、項目1に記載の塩。

(項目3)

2に關して約23.12°、約6.00°、および約19.70°においてピークを含むX線粉末回折パターンを有する、項目2に記載の塩。

(項目4)

実質的に図1に示すようなX線粉末回折パターンを有する、項目2に記載の塩。

(項目5)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンリン酸塩である、項目1に記載の塩。

(項目6)

2に關して約19.27°、約25.06°、および約25.77°においてピークを含むX線粉末回折パターンを有する、項目5に記載の塩。

(項目7)

実質的に図4に示すようなX線粉末回折パターンを有する、項目5に記載の塩。

(項目8)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンクエン酸塩半水和物である、項目1に記載の塩。

(項目9)

2に關して約11.93°、約18.64°、および約24.52°においてピークを含むX線粉末回折パターンを有する、項目8に記載の塩。

(項目10)

実質的に図7に示すようなX線粉末回折パターンを有する、項目8に記載の塩。

(項目11)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンヘミシュウ酸塩である、項目1に記載の塩。

(項目12)

2に關して約6.34°、約21.69°、および約31.85°においてピークを含むX線粉末回折パターンを有する、項目11に記載の塩。

(項目13)

実質的に図10に示すようなX線粉末回折パターンを有する、項目11に記載の塩。

(項目14)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンコハク酸塩である、項目1に記載の塩。

(項目15)

2に關して約27.62°、約20.65°、および約15.64°においてピークを含むX線粉末回折パターンを有する、項目14に記載の塩。

(項目16)

実質的に図13に示すようなX線粉末回折パターンを有する、項目14に記載の塩。

(項目17)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンオキソグルタル酸塩である、項目1に記載の塩。

(項目18)

2に關して約13.39°、約23.57°、および約21.22°においてピークを含むX線粉末回折パターンを有する、項目17に記載の塩。

(項目19)

実質的に図16に示すようなX線粉末回折パターンを有する、項目17に記載の塩。

(項目20)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンオキソグルタル酸塩溶媒和物である、項目1に記載の塩。

(項目21)

2に關して約26.02°、約11.53°、および約22.65°においてピークを含むX線粉末回折パターンを有する、項目20に記載の塩。

(項目22)

実質的に図19に示すようなX線粉末回折パターンを有する、項目20に記載の塩。

(項目23)

項目1から22のいずれか一項に記載の塩および薬学的に許容可能な担体を含む薬学的組成物。

(項目24)

項目1から22のいずれか一項に記載の塩および薬学的に許容可能な担体を混和することを含む、薬学的組成物を調製するための方法。

(項目25)

(R)-8-クロロ-1-メチル-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-3-ベンゾアゼピンの薬学的に許容可能な塩、ならびにその薬学的に許容可能な溶媒和物および水和物から選択される治療有効量の塩を含む剤形であって、非吸湿性剤形である剤形。

(項目26)

前記塩が、

約90%RHおよび約25で約2時間後に約2重量%未満の水；

約90%RHおよび約25で約2時間後に約1重量%未満の水；

約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.6重量%未満の水；

約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.5重量%未満の水；

約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.4重量%未満の水；

約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.3重量%未満の水；

約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.2重量%未満の水；または

約90%RHおよび約25で約2時間後に約0.1重量%未満の水

を吸收する、項目25に記載の剤形。

(項目27)

治療有効量の項目1から22のいずれか一項に記載の塩を含む剤形。

(項目28)

体重管理のための方法であって、それを必要としている個体に、治療有効量の項目1から22のいずれか一項に記載の塩、項目23に記載の薬学的組成物、または項目25から27のいずれか一項に記載の剤形を投与することを含む、方法。

(項目29)

前記体重管理が、体重減少、体重減少の維持、食物消費量の減少、食事に関連する満腹の増加、食事前の空腹感の減少、および食事間の食物摂取量の減少の1つまたは複数を含む、項目28に記載の方法。

(項目30)

規定食および運動の補助としての、項目28または29に記載の方法。

(項目31)

体重管理を必要とする前記個体が、

最初のボディマス指数 30 kg / m² を有する肥満患者；

少なくとも1つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 27 kg / m² を有する過体重の患者；ならびに

少なくとも1つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 27 kg / m² を有する過体重の患者であって、該体重関連共存状態が、高血圧症、脂質異常症、心臓血管疾患、耐糖能低下、および睡眠時無呼吸から選択される、過体重の患者

から選択される、項目 28 から 30 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 32)

第二の抗肥満剤を前記個体に投与することをさらに含む、項目 28 から 31 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 33)

前記第二の抗肥満剤が、クロルフェンテルミン、クロルテルミン、フェンペンテルミン、およびフェンテルミン、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物から選択される、項目 32 に記載の方法。

(項目 34)

抗糖尿病剤を前記個体に投与することをさらに含む、項目 28 から 33 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 35)

前記抗糖尿病剤が、メトホルミンである、項目 34 に記載の方法。

(項目 36)

個体において体重管理のための医薬の製造における、項目 1 から 22 のいずれか一項に記載の塩の使用。

(項目 37)

前記体重管理が、体重減少、体重減少の維持、食物消費量の減少、食事に関連する満腹の増加、食事前の空腹感の減少、および食事間の食物摂取量の減少の 1 つまたは複数を含む、項目 36 に記載の使用。

(項目 38)

前記医薬が、規定食および運動の補助として使用される、項目 36 または 37 に記載の使用。

(項目 39)

体重管理を必要とする前記個体が、

最初のボディマス指数 $30 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する肥満患者；

少なくとも 1 つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 $27 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する過体重の患者；ならびに

少なくとも 1 つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 $27 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する過体重の患者であって、該体重関連共存状態が、高血圧症、脂質異常症、心臓血管疾患、耐糖能低下、および睡眠時無呼吸から選択される、過体重の患者から選択される、項目 36 から 38 のいずれか一項に記載の使用。

(項目 40)

前記医薬が、第二の抗肥満剤と組み合わせて使用される、項目 36 から 39 のいずれか一項に記載の使用。

(項目 41)

前記第二の抗肥満剤が、クロルフェンテルミン、クロルテルミン、フェンペンテルミン、およびフェンテルミン、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物から選択される、項目 40 に記載の使用。

(項目 42)

前記医薬が、抗糖尿病剤と組み合わせて使用され、該抗糖尿病剤が、メトホルミンである、項目 36 から 41 のいずれか一項に記載の使用。

(項目 43)

治療によるヒトまたは動物の体の処置方法において使用するための、項目 1 から 22 のいずれか一項に記載の塩、または項目 23 に記載の薬学的組成物、または項目 25 から 27 のいずれか一項に記載の剤形。

(項目 44)

体重管理の方法において使用するための、項目 1 から 22 のいずれか一項に記載の塩、または項目 23 に記載の薬学的組成物、または項目 25 から 27 のいずれか一項に記載の剤形。

(項目45)

体重管理が、体重減少、体重減少の維持、食物消費量の減少、食事に関する満腹の増加、食事前の空腹感の減少、および食事間の食物摂取量の減少の1つまたは複数を含む、該体重管理の方法において使用するための、項目1から22のいずれか一項に記載の塩、または項目23に記載の薬学的組成物。

(項目46)

体重管理のための規定食および運動の補助として使用するための、項目1から22のいずれか一項に記載の塩、または項目23に記載の薬学的組成物、または項目25から27のいずれか一項に記載の剤形。

(項目47)

体重管理を必要とする前記個体が、

最初のボディマス指数 $30 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する肥満患者；

少なくとも1つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 $27 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する過体重の患者；ならびに

少なくとも1つの体重関連共存状態の存在下で最初のボディマス指数 $27 \text{ kg} / \text{m}^2$ を有する過体重の患者であって、該体重関連共存状態が、高血圧症、脂質異常症、心臓血管疾患、耐糖能低下、および睡眠時無呼吸から選択される、過体重の患者

から選択される、体重管理の方法において使用するための項目1から22のいずれか一項に記載の塩、または項目23に記載の薬学的組成物、または項目25から27のいずれか一項に記載の剤形。

(項目48)

第二の抗肥満剤と組み合わせて、体重管理の方法において使用するための、項目1から22のいずれか一項に記載の塩、または項目23に記載の薬学的組成物、または項目25から27のいずれか一項に記載の剤形。

(項目49)

クロルフェンテルミン、クロルテルミン、フェンペンテルミン、およびフェンテルミン、ならびにその薬学的に受容可能な塩、溶媒和物、および水和物から選択される第二の抗肥満剤と組み合わせて体重管理の方法において使用するための、項目1から22のいずれか一項に記載の塩、または項目23に記載の薬学的組成物、または項目25から27のいずれか一項に記載の剤形。

(項目50)

メトホルミンである抗糖尿病剤と組み合わせて体重管理の方法において使用するための項目1から22のいずれか一項に記載の塩、または項目23に記載の薬学的組成物、または項目25から27のいずれか一項に記載の剤形。