

【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27年1月22日(2015.1.22)

【公表番号】特表2014-532760(P2014-532760A)

【公表日】平成26年12月8日(2014.12.8)

【年通号数】公開・登録公報2014-067

【出願番号】特願2014-541013(P2014-541013)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/216	(2006.01)
A 6 1 P	19/06	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/426	(2006.01)
A 6 1 K	31/192	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/216	
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 K	31/426	
A 6 1 K	31/192	

【手続補正書】

【提出日】平成26年11月4日(2014.11.4)

【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

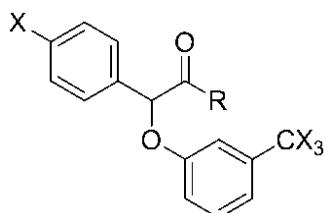
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化6】



(I)

[式中、Rは、ヒドロキシ、低級アラルコキシ、ジ-低級アルキルアミノ-低級アルコキシ、低級アルカンアミド-低級アルコキシ、ベンズアミド-低級アルコキシ、ウレイド-低級アルコキシ、N'-低級アルキル-ウレイド-低級アルコキシ、カルバモイル-低級アルコキシ、ハロフェノキシ置換低級アルコキシ、カルバモイル置換フェノキシ、カルボニル-低級アルキルアミノ、N,N-ジ-低級アルキルアミノ-低級アルキルアミノ、ハロ置換低級アルキルアミノ、ヒドロキシ置換低級アルキルアミノ、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキルアミノ、ウレイドおよび低級アルコキシカルボニルアミノからなる群から選択され；ならびに各Xは、独立して、ハロゲンである]

の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、対象によって経験される痛風発赤を治療するための薬剤。

【請求項2】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、対象によって経験される痛風発赤の数、期間、頻度または強さを減少させる薬剤。

**【請求項 3】**

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を含む、痛風に罹っている対象における高尿酸血症を治療するための薬剤であって、投与の用量、頻度および期間が、この期間中に対象によって経験される痛風発赤の数、期間、頻度または強さを減少させるのに有効であるものである薬剤。

**【請求項 4】**

前記化合物が、約 4 週間またはそれ以上投与されるものである、請求項 3 に記載の薬剤。

**【請求項 5】**

前記化合物の 1 日あたり約 100 mg ~ 約 1000 mg が投与されるものである、請求項 3 または 4 に記載の薬剤。

**【請求項 6】**

約 2.0 またはそれ以下の日中最高最低間の比で (-) - ハロフェン酸を対象に提供するための薬剤であって、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその医薬的に許容される塩を 1 日あたり約 100 mg ~ 約 1000 mg で前記対象に投与することを特徴とする薬剤。

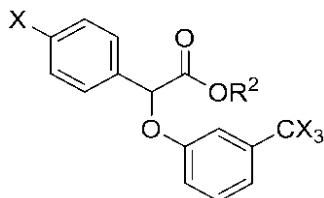
**【請求項 7】**

前記化合物が、少なくとも約 10 日間投与されるものである、請求項 6 に記載の薬剤。

**【請求項 8】**

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその医薬的に許容される塩が、式 (II)

**【化 7】**



(II)

[式中、R<sup>2</sup> は、フェニル - 低級アルキル、低級アルカンアミド - 低級アルキルおよびベンズアミド - 低級アルキルからなる群から選択され；ならびに各 X は、独立して、ハロゲンである]

の化合物またはその医薬的に許容される塩である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

**【請求項 9】**

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその医薬的に許容される塩が、(-) - ハロフェナートもしくは (-) - ハロフェン酸、またはその医薬的に許容される塩である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

**【請求項 10】**

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその医薬的に許容される塩が、(-) - ハロフェナートである、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

**【請求項 11】**

前記化合物が、経口で投与されるものである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

**【請求項 12】**

キサンチンオキシダーゼ阻害剤、尿酸生成阻害剤、尿酸排泄薬およびウリカーゼからなる群から選択される第 2 の尿酸低下薬の投与をさらに含む、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の薬剤。

**【請求項 13】**

第2の尿酸低下薬が、好ましくは、アロブリノール、フェブキソstatt、オキシブリノール、チソプリン、イノシトール、フィチン酸、ミオイノシトール、ケンフェロール、ミリセチンおよびケルセチンからなる群から選択され、特に、アロブリノールまたはフェブキソstattである、キサンチンオキシダーゼ阻害剤である、請求項12に記載の薬剤。

#### 【請求項14】

前記第1の尿酸低下薬が、( - ) - ハロフェナートであり、1日あたり約100mg～約600mgで投与され、前記第2の尿酸低下薬が、フェブキソstattであり、1日あたり約40mg～約120mgで投与されるものである、請求項12に記載の薬剤。

#### 【請求項15】

前記第2の尿酸低下薬が、尿酸排泄薬であり、好ましくは、プロベネシド、2-( (5-ブロモ-4-(4-シクロプロピルナフタレン-1-イル)-4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)チオ)酢酸、カリウム 4-(2-( (5-ブロモ-4-(4-シクロプロピルナフタレン-1-イル)-4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)チオ)アセトアミド)-3-クロロベンゾエート、R D E A 6 8 4、ベンズプロマロン、スルフィンピラゾン、アムロジピン、アトルバスタチン、フェノフィブラーート、グアイフェネシン、ロサルタン、副腎皮質刺激ホルモンおよびコルチゾンからなる群から選択され、特に、プロベネシドである、請求項14に記載の薬剤。