

【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19年5月17日(2007.5.17)

【公表番号】特表2005-531557(P2005-531557A)

【公表日】平成17年10月20日(2005.10.20)

【年通号数】公開・登録公報2005-041

【出願番号】特願2004-505050(P2004-505050)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/137 (2006.01)
A 6 1 K 31/337 (2006.01)
A 6 1 K 31/40 (2006.01)
A 6 1 K 31/439 (2006.01)
A 6 1 K 31/451 (2006.01)
A 6 1 P 1/00 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 31/137
A 6 1 K 31/337
A 6 1 K 31/40
A 6 1 K 31/439
A 6 1 K 31/451
A 6 1 P 1/00
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月23日(2007.3.23)

【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】

選択的オピエート受容体モジュレーターとして効果的な化合物の、診断および/または疾患の処置に対する薬剤の製造のための使用であって、前記疾患が摂食障害および消化器疾患から選択される前記使用。

【請求項2】

受容体モジュレーターが受容体アゴニストであることを特徴とする、請求項1に記載の使用。

【請求項3】

受容体モジュレーターが受容体に対して末梢選択的であることを特徴とする、請求項1

または 2 に記載の使用。

【請求項 4】

オピエート受容体がカップパ - オピエート受容体である、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の使用。

【請求項 5】

化合物が、アルビモパン、ロペラミド、アシマドリン、フェドトジン、ペンタゾシン、U 6 2 0 6 6 E、I C I 2 0 4 4 4 8、U - 5 0 4 8 8 H、A D L 1 0 - 0 1 0 1、A D L 1 0 - 0 1 1 6 および A D L 1 - 0 3 9 8 からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の使用。

【請求項 6】

疾患が、病的に不均衡な食欲、悪液質、食欲不振、拒食症、ジスポンデローシス、脂肪過多症、過食症、肥満症、胃不全麻痺、胃アトニー、胃麻痺、および胃腸管の狭窄から選択されることを特徴とする、請求項 1 ~ 5 に記載の使用。

【請求項 7】

胃腸緊張をモジュレートするのに効果的な薬剤の製造のための、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 8】

1 種または 2 種以上の食欲抑制薬として効果的な薬剤と共に用いられる薬剤の製造のための、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 9】

食欲抑制薬として効果的な薬剤が交換神経作用薬であることを特徴とする、請求項 8 に記載の使用。

【請求項 10】

食欲抑制薬として効果的な薬剤が、フェニルプロパノールアミン、カチン、シブトラミン、アンフェブラモン、エフェドリン、ノルシュードエフェドリンから選択されることを特徴とする、請求項 8 または 9 に記載の使用。

【請求項 11】

選択的オピエート受容体モジュレーターとして効果的な、1 種または 2 種以上の請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物、および食欲抑制薬として効果的な 1 種または 2 種以上の化合物を含む薬剤組成物。

【請求項 12】

選択的オピエート受容体モジュレーターとして効果的な少なくとも 1 種の化合物が、アルビモパン、ロペラミド、アシマドリン、フェドトジン、A D L 1 0 - 0 1 1 6、および A D L 1 - 0 3 9 8 からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 11 に記載の薬剤組成物。

【請求項 13】

食欲抑制薬として効果的な少なくとも 1 種の化合物が、フェニルプロパノールアミン、カチン、シブトラミン、アンフェブラモン、エフェドリン、およびノルシュードエフェドリンからなる群から選択されることを特徴とする、請求項 11 または 12 に記載の薬剤組成物。

【請求項 14】

病的に不均衡な食欲、悪液質、食欲不振、拒食症、ジスポンデローシス、脂肪過多症、過食症、肥満症、胃不全麻痺、胃アトニー、胃麻痺、および胃腸管の狭窄から選択される疾患の処置のための、請求項 11 ~ 13 のいずれかに記載の薬剤組成物の使用。

【請求項 15】

選択的オピエート受容体モジュレーターとして効果的な 1 種または 2 種以上の請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物、食欲抑制薬として効果的な 1 種または 2 種以上の請求項 8 ~ 10 のいずれかに記載の化合物、および任意に、1 種または 2 種以上の賦形剤、および/または 1 種または 2 種以上の補助剤を共に混合し、投与に好適な薬剤組成物へと変換することを特徴とする、請求項 11 ~ 13 のいずれかに記載の薬剤組成物の製造方法。

【請求項 16】

選択的オピエート受容体モジュレーターとして効果的な少なくとも 1 種の請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物、および食欲抑制薬として効果的な少なくとも 1 種の請求項 8 ~ 10 のいずれかに記載の化合物の治療有効量を含むことを特徴とする薬剤組成物。

【請求項 17】

(a) 選択的オピエート受容体モジュレーターとして効果的な 1 種または 2 種以上の請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物、および / またはそれらの塩および / または溶媒和物、および

(b) 食欲抑制薬として効果的な 1 種または 2 種以上の請求項 8 ~ 10 のいずれかに記載の化合物、および / またはそれらの塩および / または溶媒和物の分離パックを含むセット。

【請求項 18】

1 種または 2 種以上の選択的オピエート受容体モジュレーターを、そのような処置を必要とする患者に高用量で投与することを特徴とする、肥満症の処置方法。

【請求項 19】

用量が 1 日当たり約 2 . 0 m g / k g ~ 1 日当たり約 10 m g / k g の範囲であることを特徴とする、請求項 18 に記載の処置方法。

【請求項 20】

1 種または 2 種以上の選択的オピエート受容体モジュレーターを、そのような処置を必要とする患者により低い用量で投与することを特徴とする、食欲不振の処置方法。

【請求項 21】

用量が 1 日当たり約 0 . 1 m g / k g ~ 1 日当たり約 1 . 9 m g / k g の範囲であることを特徴とする、請求項 20 に記載の処置方法。

【請求項 22】

化合物がアシマドリンまたはその薬学的に許容される塩であり、診断および / または疾患の処置が、前記アシマドリンまたはその薬学的に許容される塩を対象に投与することであり、疾患が摂食障害である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 23】

摂食障害が、悪液質、胃不全麻痺、胃アトニー、胃麻痺、および胃腸管の狭窄からなる群から選択される、請求項 22 に記載の使用。

【請求項 24】

アシマドリンまたはその薬学的に許容される塩が、飽満をモジュレートするために効果的である、請求項 22 に記載の使用。

【請求項 25】

アシマドリンまたはその薬学的に許容される塩が、1 つまたは 2 つ以上の食後の症状をモジュレートするために効果的である、請求項 22 に記載の使用。

【請求項 26】

食後の症状が、膨満、膨満感、吐き気および食物摂取後の疼痛からなる群から選択される、請求項 25 に記載の使用。

【請求項 27】

食後の症状が、食物摂取後の疼痛である、請求項 25 に記載の使用。

【請求項 28】

アシマドリンまたはその薬学的に許容される塩が、胃腸緊張をモジュレートするために効果的である、請求項 22 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】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

本発明の摂食疾患および消化器疾患は、制限はしないが、例えば、妊娠、ガン、インフルエンザまたはHIVなどの感染症により誘発される、術後の副作用としての、もしくは異化代謝の結果としての病的に不均衡な食欲、食欲の喪失または減少した食欲、悪液質、食欲不振、とりわけ拒食症、ジスポンデロシス（dysponderosis）、脂肪過多症、過食症、肥満症、胃不全麻痺、とりわけ神経性胃不全麻痺、糖尿病性胃不全麻痺、筋原性胃不全麻痺もしくは薬により誘発される胃不全麻痺、胃アトニー、胃麻痺もしくは腸不全麻痺（enteroparesis）、とりわけGI - 手術後のもの、および胃腸管の狭窄、とりわけ幽門の狭窄を含む。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0013

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0013】

従って、本発明の好ましい態様は、選択的オピエート受容体モジュレーター、とりわけ末梢選択的なオピエート受容体モジュレーターとして効果的な化合物の、病的に不均衡な食欲、食欲不振、脂肪過多症、過食症、肥満症、胃不全麻痺、および胃腸管の狭窄、ならびにとりわけ拒食症、過食症、肥満症、糖尿病性胃不全麻痺、および幽門の狭窄から選択される疾患の処置に対する薬剤の製造のための使用に関する。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0032

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0032】

好ましい通常の食欲抑制薬は、フェニルプロパノールアミン、カチン（Cathin）、シブトラミン（Sibutramin）、アンフェプラモン（amfetramon）、エフェドリンおよびノルシュードエフェドリン（Norpseudoephedrin）およびそれらの塩、とりわけ塩酸フェニルプロパノールアミン、塩酸カチン、塩酸シブトラミン、塩酸アンフェプラモン、塩酸エフェドリンおよび塩酸ノルシュードエフェドリンからなる群から選択される。上記した通常の食欲抑制薬は、一般的に交感神経作用薬と呼ばれる。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0036

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0036】

本発明の他の面は、疾病の処置のための上記の薬剤組成物の使用に関し、前記疾病は、病的に不均衡な食欲、悪液質、食欲不振、拒食症、ジスポンデロシス、脂肪過多症、過食症、肥満症、胃不全麻痺、胃アトニー、胃麻痺、および胃腸管の狭窄からなる群から選択される。この面で、該疾病は、好ましくは、病的に不均衡な食欲、脂肪過多症、または肥満症からなる群から選択される。