

【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28年4月28日(2016.4.28)

【公表番号】特表2015-509971(P2015-509971A)

【公表日】平成27年4月2日(2015.4.2)

【年通号数】公開・登録公報2015-022

【出願番号】特願2014-561471(P2014-561471)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/519 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 13/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 13/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 37/08 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/70 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/10 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/06 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/12 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4402 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4545 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/573 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/192 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/196 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/127 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/107 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/10 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/18 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/16 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/22 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/12 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/14 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/20 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/08 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/34 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/24 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/519  
 A 6 1 P 17/04  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 31/12  
 A 6 1 P 31/04  
 A 6 1 P 31/10  
 A 6 1 P 13/04  
 A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 37/08  
 A 6 1 K 9/70  
 A 6 1 K 9/10  
 A 6 1 K 9/06  
 A 6 1 K 9/12  
 A 6 1 K 31/4402  
 A 6 1 K 31/4545  
 A 6 1 K 31/573  
 A 6 1 K 31/192  
 A 6 1 K 31/196  
 A 6 1 K 9/127  
 A 6 1 K 9/107  
 A 6 1 K 47/10  
 A 6 1 K 47/18  
 A 6 1 K 47/16  
 A 6 1 K 47/22  
 A 6 1 K 47/12  
 A 6 1 K 47/14  
 A 6 1 K 47/20  
 A 6 1 K 47/08  
 A 6 1 K 47/34  
 A 6 1 K 47/24

## 【手続補正書】

【提出日】平成28年3月10日(2016.3.10)

## 【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

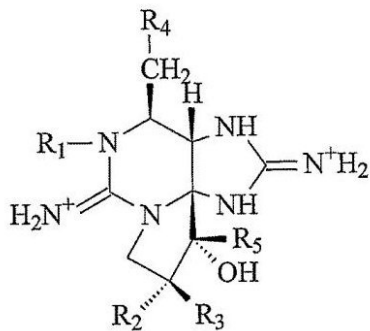
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの局所的処置方法で使用するための麻痺性貝毒（PSP）であって、ここでPSPは、次の式（I）：

【化1】



式 I

式中、 $R_1$  および  $R_5$  は独立して、 $-H$  および  $-OH$  からなる群から選択され； $R_2$  および  $R_3$  は独立して、 $-H$ 、 $-OSO_3^-$  および  $-SO_3^-$  からなる群から選択され；および

$R_4$  は、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OC(=O)NH_2$ 、 $-OC(=O)NHSO_3^-$  および  $-OC(=O)CH_3$  からなる群から選択される、

で表されるサキシトキシンまたは三環式 3, 4 - プロピノペルヒドロプリンであるか、または P S P は、サキシトキシンもしくは三環式 3, 4 - プロピノペルヒドロプリンの塩である、前記麻痺性貝毒。

【請求項 2】

$R_2$  および  $R_3$  のいずれか一方が  $-OSO_3^-$  であるか、または  $R_4$  が  $-OC(=O)NHSO_3^-$  である、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 に記載の P S P。

【請求項 3】

三環式 3, 4 - プロピノペルヒドロプリンが、ネオサキシトキシン、デスカルバモイルサキシトキシン、またはゴニアウトキシン (G T X)、特に G T X - 1、G T X - 2、G T X - 3、G T X - 4、または G T X - 5 である、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 または 2 に記載の P S P。

【請求項 4】

P S P が、そのラセミ体、純粋な立体異性体、特にエナンチオマーまたはジアステレオマーの形態、または立体異性体の混合物、特にエナンチオマーもしくはジアステレオマーの混合物の形態、中性形態、酸または塩基の形態、または塩の、特に生理学的に許容し得る塩の形態、または溶媒和物の、特に水和物の形態である、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の P S P。

【請求項 5】

P S P が、サキシトキシン、ネオサキシトキシン、デスカルバモイルサキシトキシン、または G T X、特に G T X - 1、G T X - 2、G T X - 3、G T X - 4、または G T X - 5 であり、ここでサキシトキシン、ネオサキシトキシン、デスカルバモイルサキシトキシン、または G T X、特に G T X - 1、G T X - 2、G T X - 3、G T X - 4、または G T X - 5 が、合成的に合成されるか、生物学的供給源から単離される、特にシアノバクテリアから、渦鞭毛藻類から、または汚染された貝類から、特に *A. catenella* で汚染された貝類から単離されることを特徴とする、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の P S P。

【請求項 6】

P S P が、 $0.01 \mu g / 日 \sim 1000 \mu g / 日$  の量で、特に  $0.1 \sim 100 \mu g / 日$ 、より特に  $1 \sim 10 \mu g / 日$  の量で使用するサキシトキシン、ネオサキシトキシン、デスカルバモイルサキシトキシン、または G T X、特に G T X - 1、G T X - 2、G T X - 3、G T X - 4、または G T X - 5 である、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の P S P。

【請求項 7】

P S P が、三環式 3, 4 - プロピノペルヒドロプリンであり、三環式 3, 4 - プロピノペルヒドロプリンが、合成的に合成されるか、または生物学的供給源から単離される、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の P S P。

【請求項 8】

痒みが、搔痒感応性の性質の、神経性の性質の、神経障害性の性質の、心因性の性質の、炎症過程による、虫刺されによる、炎症過程、特に手術や治療による炎症過程による、感染過程、特にウイルス、細菌、真菌またはプリオンによって引き起こされる感染過程による、循環する起痒物質による、全身性病理、特に胆石症または急性もしくは慢性腎不全による、任意のアレルゲンへの暴露による、タバコへの暴露、特に無煙タバコへの暴露による、化学物質への暴露による、または呼吸性の原因によるものである、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の P S P。

【請求項 9】

P S P が、単回使用または 1 ~ 7 日の期間にわたって使用するための、複数の処置サイクルで使用するための、および / または長期的処置で使用するためのものである、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の P S P。

【請求項 1 0】

P S P が、皮膚パッチ、クリーム、軟膏またはスプレーの使用により、および / または物理的経皮送達方法の使用により、特にイオン浸透療法、音波浸透法、ソノマクロポレーション、温度調節または磁気調節により、または物理的デバイス、特に呼吸装置、特に噴霧器の使用により、局所投与で用いるための、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の P S P。

【請求項 1 1】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 つの P S P、および薬理的に許容し得る担体を含む、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための医薬組成物であって、医薬組成物が局所投与のために調製される、前記医薬組成物。

【請求項 1 2】

P S P を、0 . 0 1 ~ 1 0 0 0  $\mu$  g、特に 0 . 1 ~ 1 0 0  $\mu$  g、より特に 1 ~ 1 0  $\mu$  g の P S P を 1 日当たり投与するのに適した量で含有する、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

P S P を、0 . 0 1 ~ 1 0 0 0  $\mu$  g / m l、特に 0 . 1 ~ 1 0 0  $\mu$  g / m l、より特に 1 ~ 1 0  $\mu$  g / m l の濃度で含有する、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 1 または 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

局所投与のために調製された医薬組成物が、皮膚パッチ、クリーム、軟膏、またはスプレーである、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

医薬組成物がさらに、少なくとも 1 つの止痒化合物を、特に抗ヒスタミン化合物、特にクロルフェナミン、ロラタジンまたはデスロラタジン、コルチコステロイド、特にベタメタゾン、クロベタゾールまたはモメタゾン、または非ステロイド性抗炎症薬、特にイブプロフェン、ケトプロフェンまたはジクロフェナクを含む、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

P S P が、リポソームまたはマイクロエマルジョンに含有されていることを特徴とする、および / または医薬組成物がさらに、皮膚を介した P S P の輸送を促進する少なくとも 1 つの物質を、特に以下からなる群から選択される物質を含むことを特徴とする、ヒトまたは他の哺乳動物における痒みの処置方法で使用するための、請求項 1 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物：アルコール、アミン、アミド、アミノ酸、アミノ酸エステル、1 - 置換アザシクロヘプタン - 2 - オン、ピロリドン、テルペン、脂肪酸、脂肪酸エステル、大環状化合物、界面活性剤、スルホキシド、リポソーム、トランスフェルソーム、レシチン小胞、エトソーム、アニオン性、カチオン性および非イオン性界面活性剤、ポリオール、精油、ジメチルスルホキシド、デシルメチルスルホキシド、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ラウリン酸ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウム、臭化セチルトリメチルアンモニウム、塩化ベンザルコニウム、ポロキサマー、ポリソルベート 2 0 (ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート)、ポリソルベート 4 0 (ポリオキシエチレンソルビタンモノパルミテート)、ポリソルベート 6 0 (ポリオキシエチレンソルビタンモノステアレート)、ポリソルベート 8 0 (ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート)、レシチン、1 - n - ドデシルシクロヘプタン - 2 - オン、エタノール、プロパノール、オクタノール、ベンジルアルコ

ール、ラウリン酸、オレイン酸、吉草酸、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、メチルプロピオン酸塩、オレイン酸エチル、セスキオレイン酸ソルビタン、プロピレングリコール、エチレングリコール、グリセロール、ブタンジオール、ポリエチレングリコール、ポリエチレングリコールモノラウレート、尿素、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、2 - ピロリドン、1 - メチル - 2 - ピロリドン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン、アルカノン、サリチル酸、サリチル酸塩、クエン酸、およびコハク酸。