

【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】令和 2 年 11 月 19 日 (2020.11.19)

【公表番号】特表 2019-532069 (P2019-532069A)

【公表日】令和 1 年 11 月 7 日 (2019.11.7)

【年通号数】公開・登録公報 2019-045

【出願番号】特願 2019-520031 (P2019-520031)

【国際特許分類】

C 07C 233/18 (2006.01)

A 61K 47/54 (2017.01)

A 61K 31/225 (2006.01)

A 61K 31/22 (2006.01)

C 07H 15/04 (2006.01)

A 61K 31/7028 (2006.01)

A 61K 31/661 (2006.01)

A 61K 9/08 (2006.01)

A 61K 9/20 (2006.01)

A 61K 9/48 (2006.01)

A 61K 9/06 (2006.01)

A 61K 9/10 (2006.01)

A 61K 9/14 (2006.01)

A 61K 9/107 (2006.01)

A 61K 9/12 (2006.01)

A 61P 25/04 (2006.01)

A 61P 25/22 (2006.01)

A 61P 25/24 (2006.01)

A 61P 25/18 (2006.01)

A 61P 21/02 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 25/14 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 25/08 (2006.01)

A 61P 1/00 (2006.01)

A 61P 1/02 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 27/06 (2006.01)

A 61P 37/08 (2006.01)

A 61P 17/00 (2006.01)

A 61P 11/00 (2006.01)

A 61P 3/04 (2006.01)

A 61P 25/20 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

C 07C 233/20 (2006.01)

C 07F 9/09 (2006.01)

【 F I 】

C 07C 233/18

A 6 1 K	47/54	
A 6 1 K	31/225	
A 6 1 K	31/22	
C 0 7 H	15/04	C S P F
A 6 1 K	31/7028	
A 6 1 K	31/661	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	9/48	
A 6 1 K	9/06	
A 6 1 K	9/10	
A 6 1 K	9/14	
A 6 1 K	9/107	
A 6 1 K	9/12	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	21/02	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	25/20	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
C 0 7 C	233/20	
C 0 7 F	9/09	U

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月9日(2020.10.9)

【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 - a :

 $X_1 - X_2$

の化合物であって、式中、

X_1 は、N - アシルエタノールアミドであり、

X_2 は、前記 N - アシルエタノールアミドにコンジュゲートされた部分である、化合物。

【請求項 2】

塩の形態である、請求項 1 に記載の化合物。

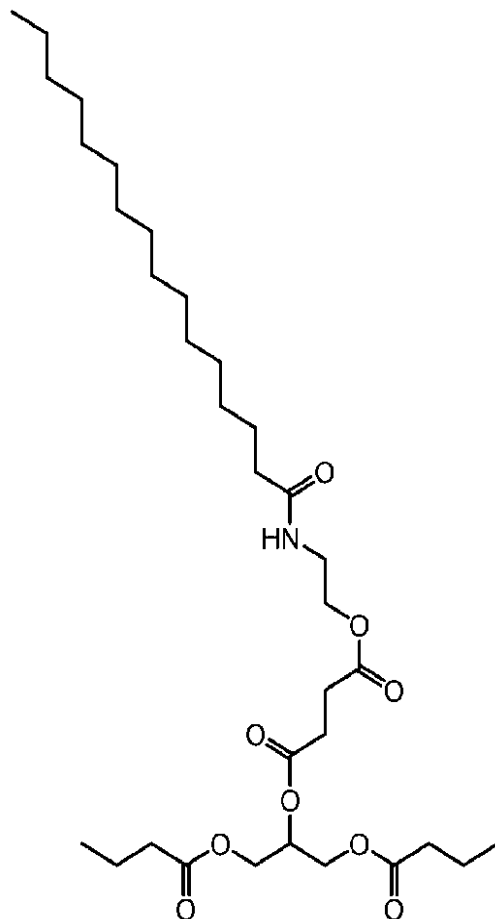
【請求項 3】

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

以下：

【化 8 5】

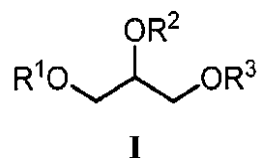


である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

式 I：

【化 8 6】



の化合物であって、式中、

R^1 、 R^2 または R^3 はそれぞれ、独立して、水素または - T - R^4 であり、 R^1 、 R^2 または R^3 のうちの少なくとも 1 つは、- T - R^4 であり、

- T - は、二価部分を表し、

R^4 は、 $C_{1 \sim 40}$ 脂肪族、 $-C(O)R$ および X_1 からなる群より選択される、必要に応じて置換された基であり、

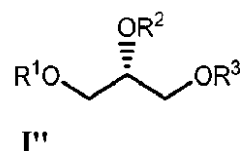
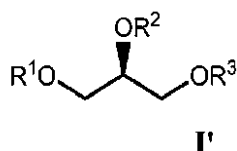
R は、水素および必要に応じて置換された $C_{1 \sim 20}$ 脂肪族からなる群より選択され、

X_1 は、 N -アシルエタノールアミドである、
化合物。

【請求項 6】

式 I' または I'' :

【化 87】



である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7】

塩の形態である、請求項 5 または 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

式 $I-b$:

$X_1 - X_3$

$I-b$

の化合物であって、式中、

X_1 は、 N -アシルエタノールアミドであり、

X_3 は、 $-(CH_2)_m-P(O)(OR)_2$ 、 $C_{1 \sim 40}$ 脂肪族、 $-T-X_4$ からなる群より選択される、必要に応じて置換された基であり、さらに、

m は、 $0 \sim 10$ からなる群より選択される整数であり、

$-T-$ は、二価部分を表し、

X_4 は、糖部分であり、一部の特定の実施形態では、 X_4 は、二糖、例えば、スクロースである、
化合物。

【請求項 10】

塩の形態である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

X_1 が、 N -パルミトイルエタノールアミド、 N -オレオイルエタノールアミドおよび N -アラキドノイルエタノールアミドからなる群より選択される、請求項 1 から 3 または 9 から 11 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 13】

X_1 が、 N -パルミトイルエタノールアミドである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

X_2 が、ホスフェート、酪酸、グリセロール、スクシネート、カプリル酸、グルコン酸、エイコサペンタエン酸、リノール酸、スクシネートおよびスクロースの部分、またはそれらの組み合わせからなる群より選択される部分を含む、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 15】

R^1 が、 $-T-R^4$ であり、 R^2 および R^3 が水素である、請求項 5 から 8 のいずれかに記載の化合物。

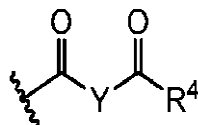
【請求項 16】

R^2 が、 $-T-R^4$ であり、 R^1 および R^3 が水素である、請求項 5 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 17】

R^1 、 R^2 または R^3 のうちの少なくとも 1 つが、

【化 88】

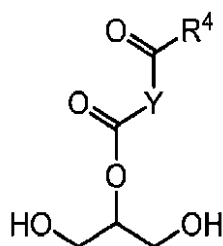


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状 C_{1-10} 炭化水素鎖である、請求項 5 から 8 または 15 から 16 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 18】

式 I I :

【化 89】

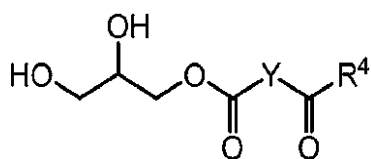


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状 C_{1-10} 炭化水素鎖である、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

式 I I I :

【化 90】

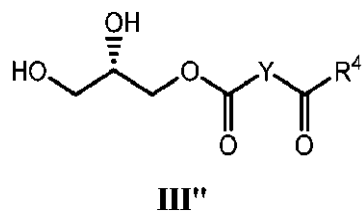
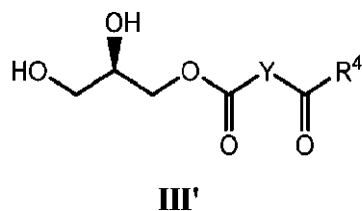


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状 C_{1-10} 炭化水素鎖である、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 20】

式 I I I ' または I I I '' :

【化 91】



である、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

Y が、二価の直鎖または分岐状 C_{1-6} 炭化水素鎖である、請求項 17 から 20 のい

れかに記載の化合物。

【請求項 2 2】

Y が、プロピレンである、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

Y が、エチレンである、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

Y が、メチレンである、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

X₃ が、- (CH₂)_m - PO (OR)₂ である、請求項 9 から 1 1 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 2 6】

X₃ が、- PO (OH)₂ である、請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

X₃ が、C₁ ~ 40 脂肪族である、請求項 9 から 1 1 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 2 8】

X₃ が、- T - X₄ である、請求項 9 から 1 1 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 2 9】

- T - が、ジカルボン酸から誘導された二価部分である、請求項 5 から 1 1 または 1 5 から 1 6 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 3 0】

- T - が、コハク酸から誘導された二価部分である、請求項 2 9 に記載の化合物。

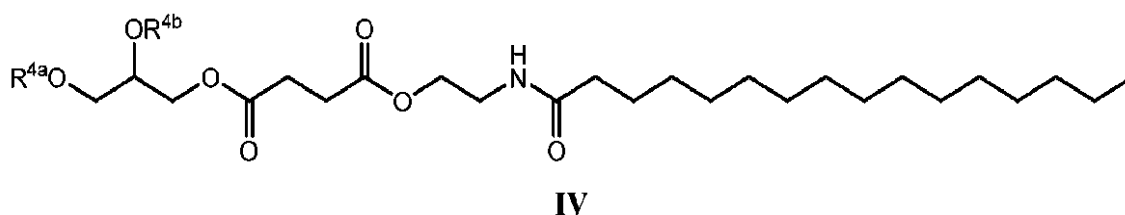
【請求項 3 1】

X₄ がスクロースである、請求項 9 から 1 1 または 2 8 から 3 0 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 3 2】

式 I V :

【化 9 2】



であり、式中、

R^{4a} および R^{4b} は、独立して、水素、- C (O) R' または - C (O) - Y - C (O) OR' であり、

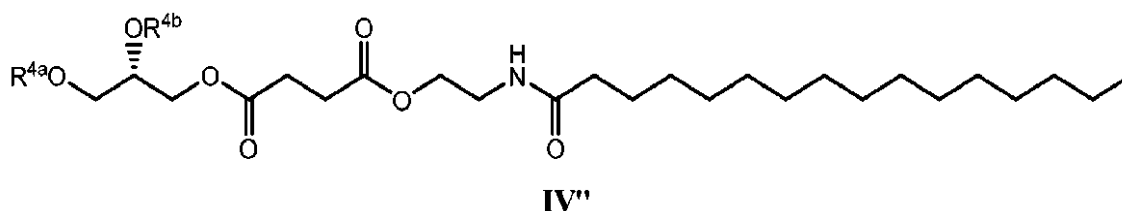
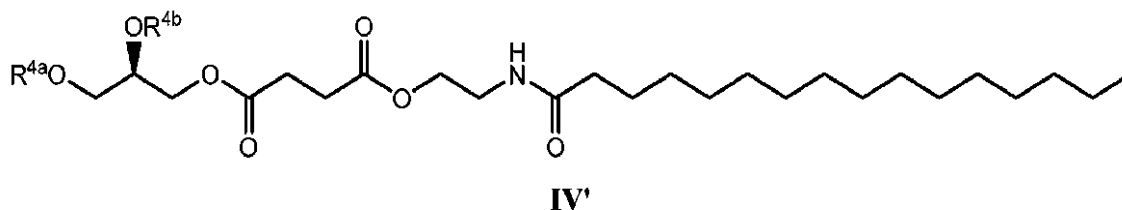
R' はそれぞれ、水素、および必要に応じて置換された C₁ ~ 20 脂肪族からなる群より独立して選択され、

Y はそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 C₁ ~ 20 炭化水素鎖である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 3 3】

式 I V' または I V'' :

【化 9 3】



である、請求項 3 2 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

塩の形態である、請求項 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

R^{4a} および R^{4b} が水素である、請求項 3 2 から 3 5 のいずれかに記載の化合物。

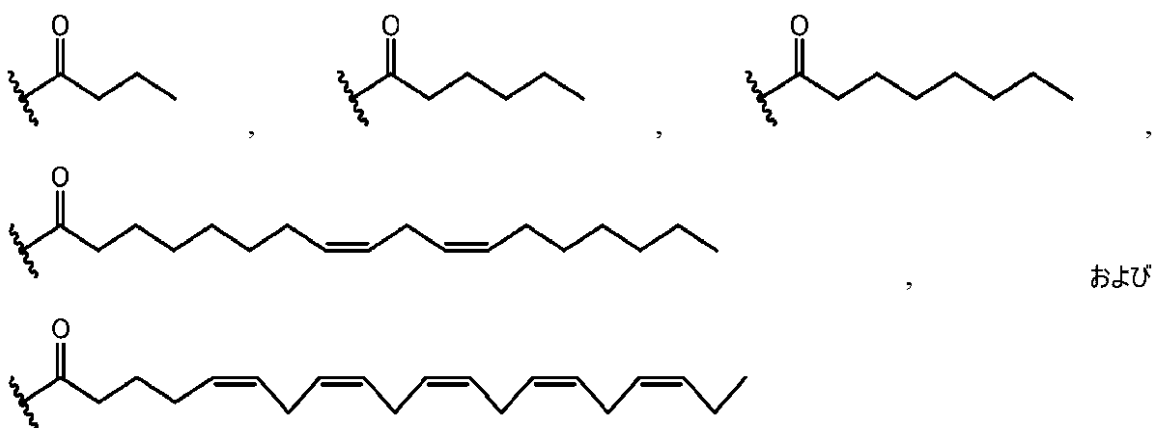
【請求項 3 7】

R^{4a} および R^{4b} が独立して、 $-C(O)R'$ である、請求項 3 2 から 3 5 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 3 8】

R^{4a} および R^{4b} が、

【化 9 4】



からなる群より独立して選択される、請求項 3 7 に記載の化合物。

【請求項 3 9】

R^{4a} および R^{4b} が独立して、 $-C(O)-Y-C(O)OR'$ である、請求項 3 2 から 3 5 のいずれかに記載の化合物。

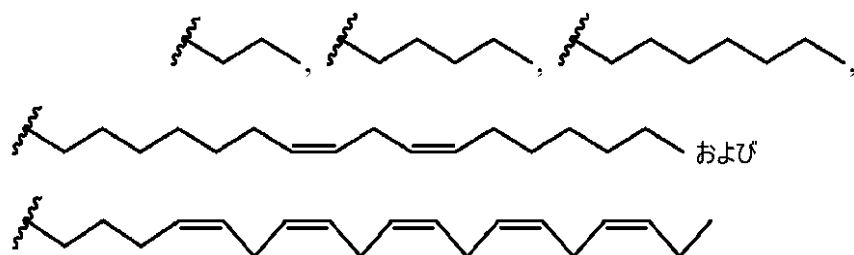
【請求項 4 0】

R' が水素である、請求項 3 9 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

R' がそれぞれ、

【化 9 5】



からなる群より独立して選択される、請求項 40 に記載の化合物。

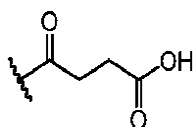
【請求項 4 2】

Y がそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 $C_1 \sim 6$ 炭化水素鎖である、請求項 39 から 41 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 4 3】

R^{4a} および R^{4b} が、

【化 9 6】

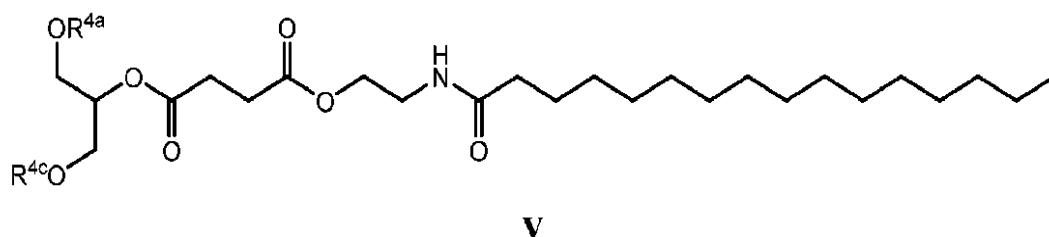


である、請求項 39 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

式 V :

【化 9 7】



であり、式中、

R^{4a} および R^{4c} は、独立して、水素、 $-C(O)R'$ または $-C(O)-Y-C(O)OR'$ であり、

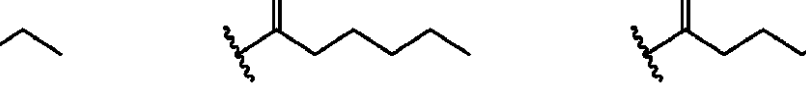
R' はそれぞれ、水素、および必要に応じて置換された $C_1 \sim 20$ 脂肪族からなる群より独立して選択され、

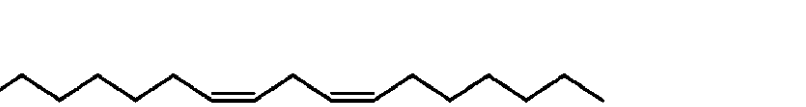
Y はそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 $C_1 \sim 20$ 炭化水素鎖である、請求項 5 に記載の化合物。


【請求項 4 5】

式 V' または V'' :

CCCCCCCCCCCCCCCC(=O)NCCOC(=O)CCC(=O)OC[C@H](COC(=O)R4c)COC(=O)R4aCCCCCCCCCCCCCCCC(=O)NCCOC(=O)CCC(=O)O[C@H](COC(=O)R⁴²)[C@@H](COC(=O)R^{4c})

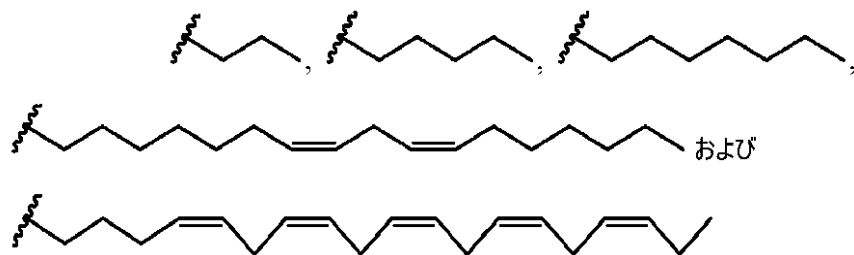






R' がそれぞれ、

【化 1 0 0】



からなる群より独立して選択される、請求項 5 0 に記載の化合物。

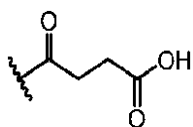
【請求項 5 3】

Y がそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 $C_1 \sim 6$ 炭化水素鎖である、請求項 5 0 から 5 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5 4】

R^{4a} および R^{4c} が、

【化 1 0 1】

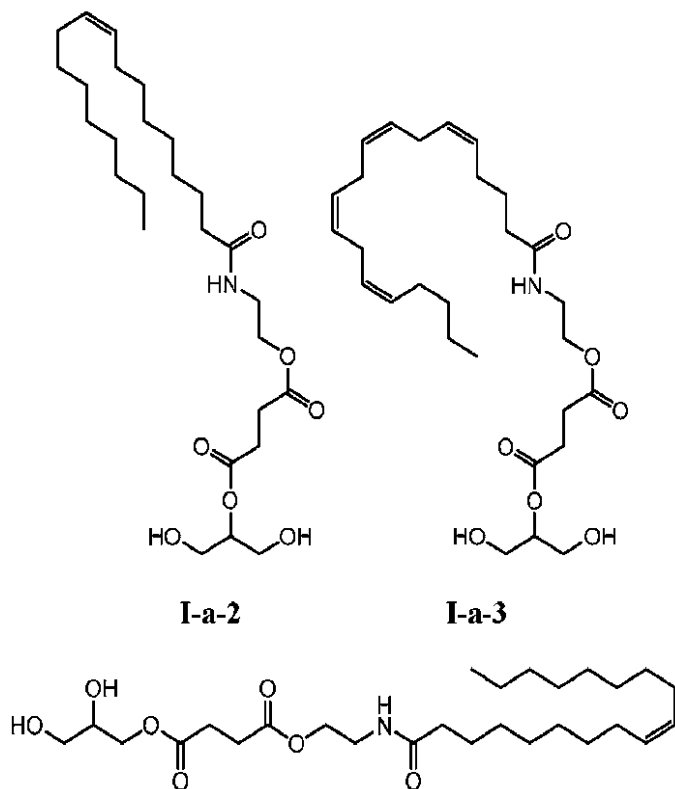


である、請求項 5 3 に記載の化合物。

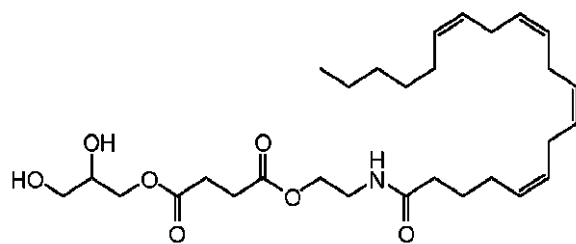
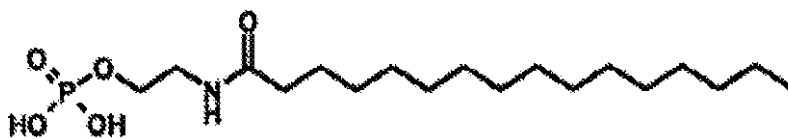
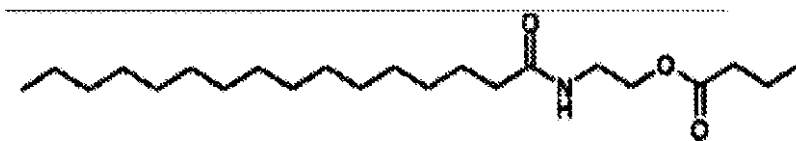
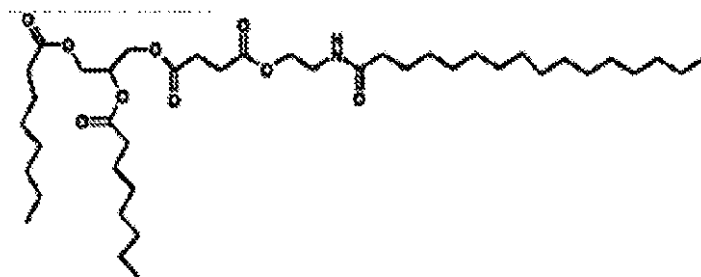
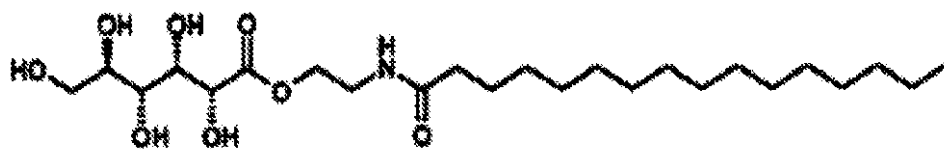
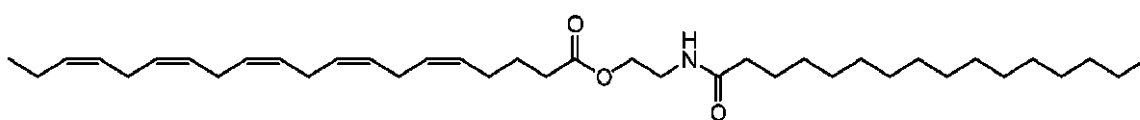
【請求項 5 5】

以下：

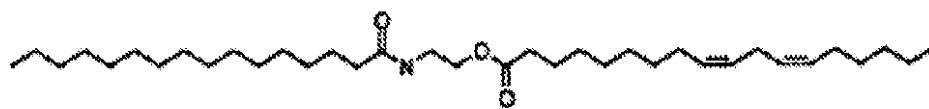
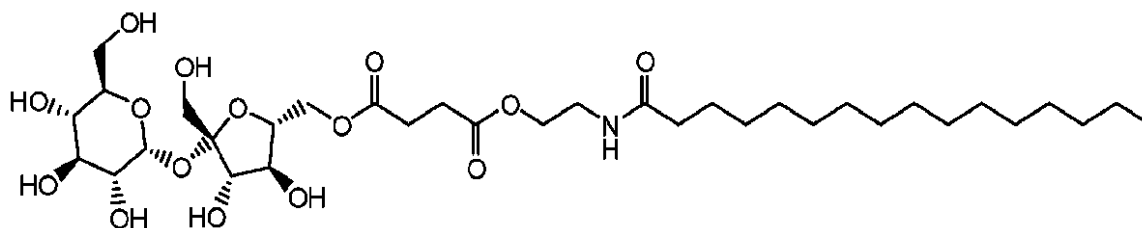
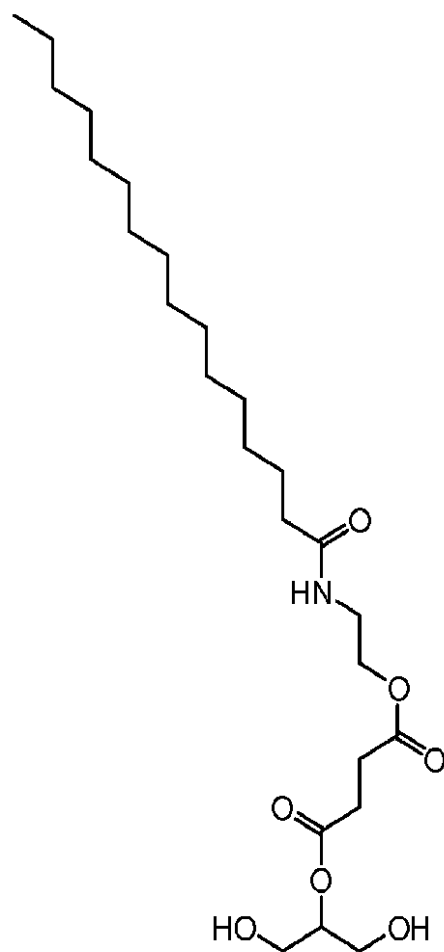
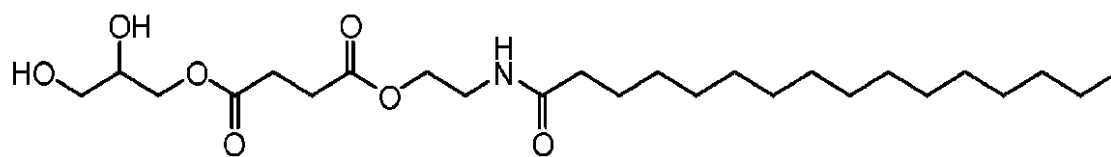
【化 1 0 2 - 1】



【化 1 0 2 - 2】

I-a-5**I-a-6.****I-1****I-2****I-3****I-4****I-5**

【化 1 0 2 - 3】

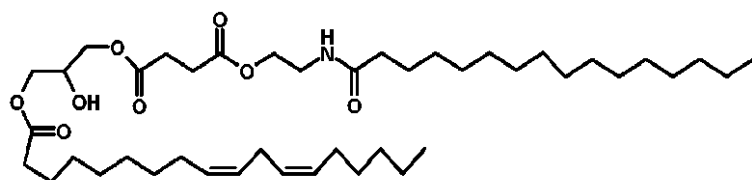
**I-6****I-7****I-8 or****I-9**

から選択される化合物。

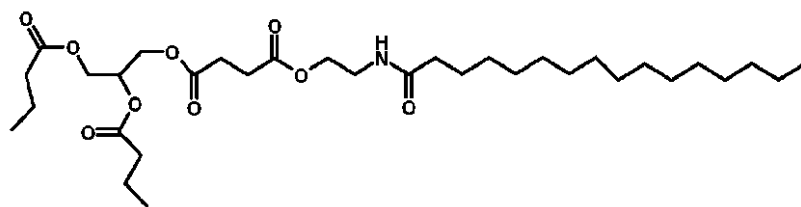
【請求項 5 6】

以下：

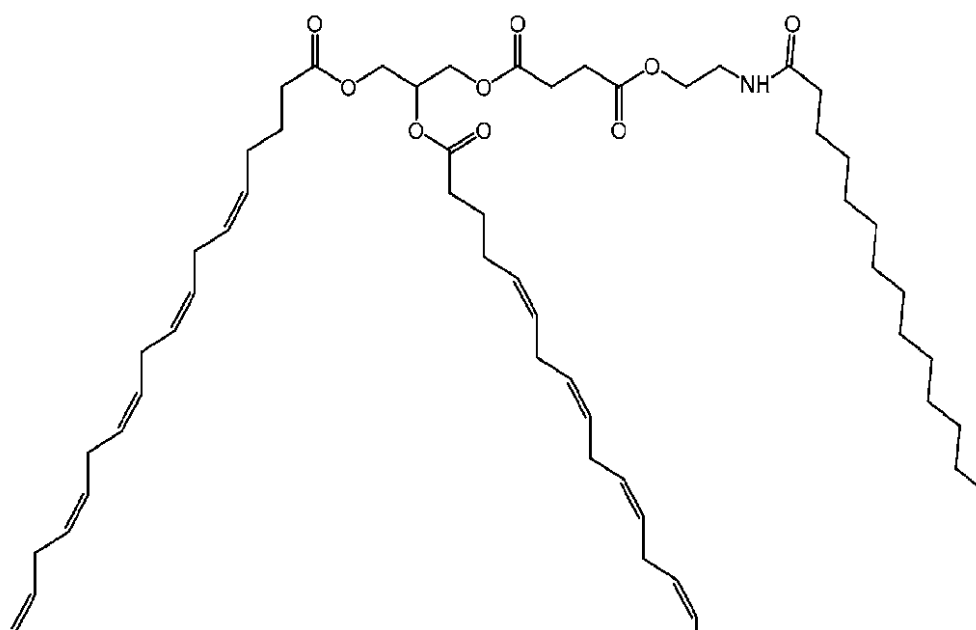
【化 1 0 3 - 1】



I-10

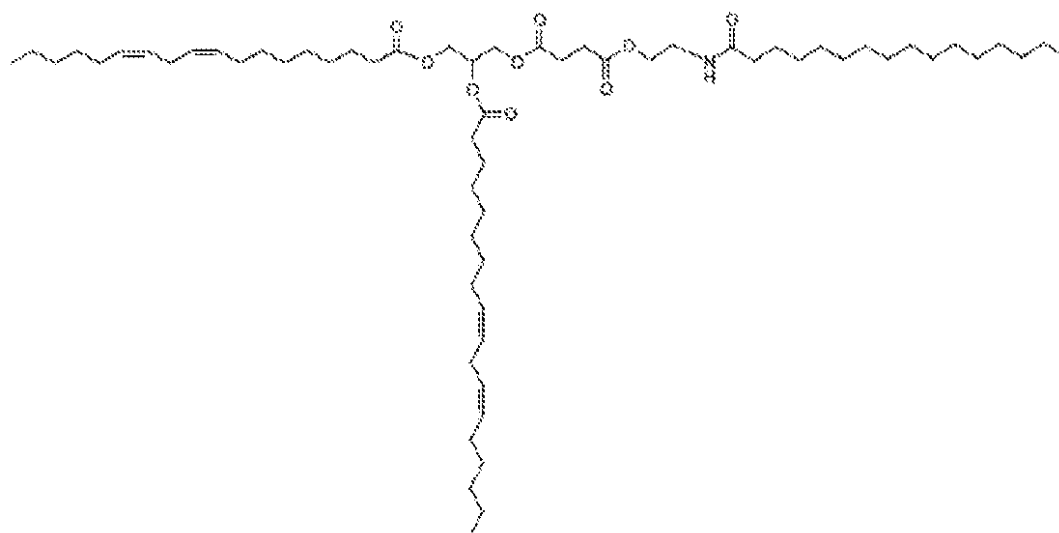
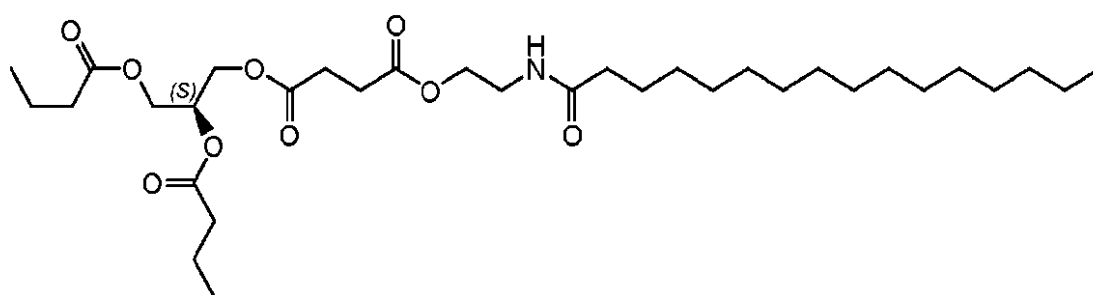
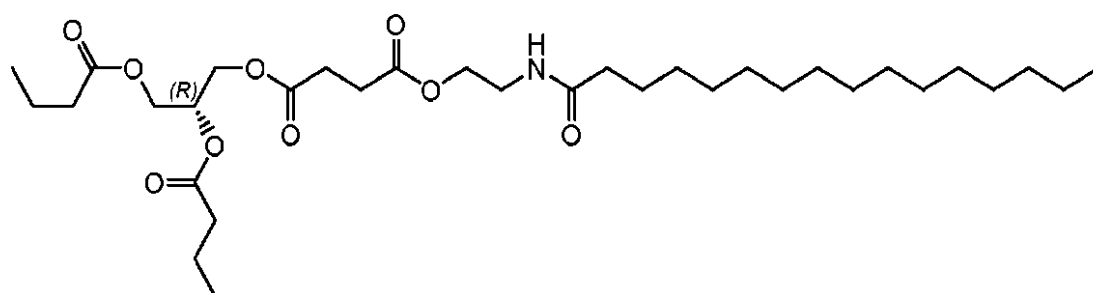


I-11

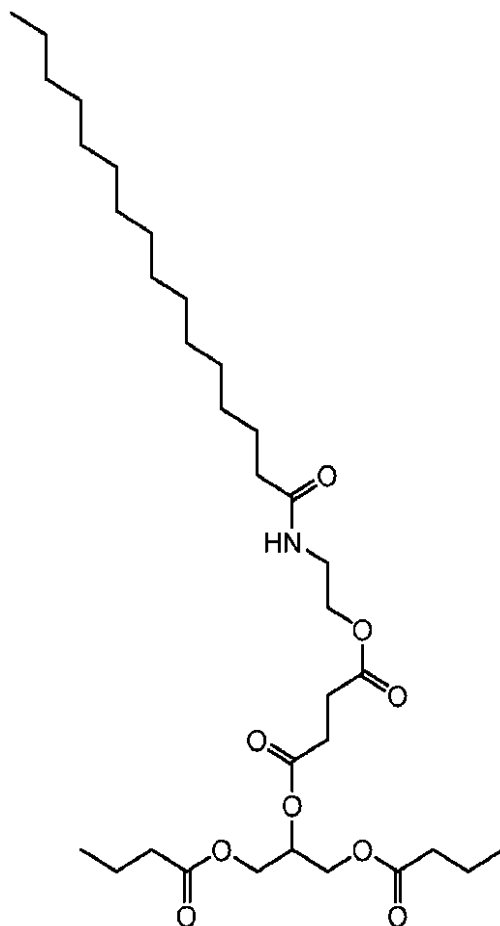


I-12

【化 1 0 3 - 2】

**I-13****I-14****I-15** または

【化 1 0 3 - 3】



I-16

から選択される化合物。

【請求項 5 7】

塩の形態である、請求項 5 5 または 5 6 に記載の化合物。

【請求項 5 8】

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、請求項 5 7 に記載の化合物。

【請求項 5 9】

1 個または複数の水素原子が、重水素原子により置き換えられている、請求項 1 から 5 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6 0】

R^1 、 R^2 または R^3 のうちの 1 つまたは複数が、重水素であるか、または重水素を含有する、請求項 5 から 8、1 4 から 2 4、および 2 9 から 3 1 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6 1】

N - アシルエタノールアミドである参照化合物と比べて、水性の系での改善された溶解度を示すことができることを特徴とする、請求項 1 から 6 0 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6 2】

前記参照化合物と比べて、改善された安定性を示すことができることを特徴とする、請求項 1 から 6 1 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6 3】

前記参照化合物と比べて、異なって代謝されることを特徴とする、請求項 1 から 6 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6 4】

前記参照化合物と比べて、異なる速度で代謝される、請求項 6 3 に記載の化合物。

【請求項 6 5】

前記参照化合物が、親 N - アシルエタノールアミド化合物である、請求項 6 1 から 6 4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6 6】

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - パルミトイルエタノールアミドである、請求項 6 5 に記載の化合物。

【請求項 6 7】

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - オレオイルエタノールアミドである、請求項 6 5 に記載の化合物。

【請求項 6 8】

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - アラキドノイルエタノールアミドである、請求項 6 5 に記載の化合物。

【請求項 6 9】

投与されると、N - アシルエタノールアミド化合物またはその活性代謝産物を送達することを特徴とする、請求項 1 から 6 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7 0】

前記 N - アシルエタノールアミド化合物が、親 N - アシルエタノールアミド化合物である、請求項 6 9 に記載の化合物。

【請求項 7 1】

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - パルミトイルエタノールアミドである、請求項 6 9 に記載の化合物。

【請求項 7 2】

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - オレオイルエタノールアミドである、請求項 6 9 に記載の化合物。

【請求項 7 3】

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - アラキドノイルエタノールアミドである、請求項 7 0 に記載の化合物。

【請求項 7 4】

請求項 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物および薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 7 5】

前記医薬組成物が、室温で液体であることを特徴とする、請求項 7 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 7 6】

前記医薬組成物が、経口送達のために製剤化されている、請求項 7 4 または 7 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7 7】

前記医薬組成物が、固形製剤として製剤化されている、請求項 7 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 7 8】

前記医薬組成物が、液体製剤として製剤化されている、請求項 7 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 7 9】

前記固形製剤が錠剤である、請求項 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8 0】

前記固形製剤がカプセル剤である、請求項 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8 1】

前記カプセル剤が、液体を封入している、請求項 8 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 8 2】

前記カプセル剤が、ゲルを封入している、請求項 8 0 に記載の医薬製剤。

【請求項 8 3】

前記カプセル剤が、固体を封入している、請求項 8 0 に記載の医薬製剤。

【請求項 8 4】

前記医薬組成物が、液体であるか、または液体を含む、請求項 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8 5】

前記医薬組成物が、ゲルであるか、またはゲルを含む、請求項 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8 6】

前記医薬組成物が、シロップであるか、またはシロップを含む、請求項 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8 7】

前記医薬組成物が、懸濁物であるか、または懸濁物を含む、請求項 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8 8】

前記医薬組成物が、粉末であるか、または粉末を含む、請求項 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8 9】

前記医薬組成物が、局所送達のために製剤化されている、請求項 7 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 9 0】

前記医薬組成物が、クリーム剤として製剤化されている、請求項 7 4 から 7 8、または 8 9 のいずれかに記載の医薬製剤。

【請求項 9 1】

前記医薬組成物が、軟膏剤として製剤化されている、請求項 7 4 から 7 8、または 8 9 のいずれかに記載の医薬製剤。

【請求項 9 2】

前記医薬組成物が、泡沫として製剤化されている、請求項 7 4 から 7 8、または 8 9 のいずれかに記載の医薬製剤。

【請求項 9 3】

被験体に経口投与されると、生物学的に活性な N - アシルエタノールアミド化合物、または生物学的に活性なその代謝産物を、前記 N - アシルエタノールアミド化合物の同等な参照医薬組成物によって達成される経口バイオアベイラビリティよりも高い経口バイオアベイラビリティで送達することを特徴とする、請求項 1 から 7 3 に記載の化合物、または請求項 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 9 4】

疾患、障害または状態に罹患している、またはそれらに罹患し易い被験体を処置するための、請求項 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物を含む組成物、または請求項 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 9 5】

前記組成物または医薬組成物が、前記被験体が罹患している前記疾患、障害もしくは状態、またはそれらの 1 つまたは複数の症状を処置する 1 つまたは複数の他の薬剤と組み合わせて投与される、請求項 9 4 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 9 6】

前記疾患、障害または状態が、疼痛であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 9 7】

前記疾患、障害または状態が、慢性下部背痛であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 ま

たは 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 9 8】

前記疾患、障害または状態が、坐骨神経痛であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 9 9】

前記疾患、障害または状態が、神経根障害であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 0】

前記疾患、障害または状態が、放散痛であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 1】

前記疾患、障害または状態が、不安であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 2】

前記疾患、障害または状態が、うつ病であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 3】

前記疾患、障害または状態が、統合失調症の 1 つまたは複数の症状を特徴とする、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 4】

前記疾患、障害または状態が、筋萎縮性側索硬化症であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 5】

前記疾患、障害または状態が、多発性硬化症であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 6】

前記疾患、障害または状態が、神経学的疾患、障害または状態であるかまたはそれらを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 7】

前記疾患、障害または状態が、パーキンソン病であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 8】

前記疾患、障害または状態が、アルツハイマー病であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 0 9】

前記疾患、障害または状態が、ハンチントン病であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 0】

前記疾患、障害または状態が、神経障害性疼痛であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 1】

前記疾患、障害または状態が、脳虚血であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 2】

前記疾患、障害または状態が、てんかんであるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 3】

前記疾患、障害または状態が、食欲喪失であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 4】

前記疾患、障害または状態が、歯痛であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 5】

前記疾患、障害または状態が、変形性関節症であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 6】

前記疾患、障害または状態が、消化管の運動の低下であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 7】

前記疾患、障害または状態が、がんであるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 8】

前記疾患、障害または状態が、緑内障であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 1 9】

前記疾患、障害または状態が、アトピー性皮膚炎であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 2 0】

前記疾患、障害または状態が、呼吸器感染であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 2 1】

前記疾患、障害または状態が、心的外傷後ストレス障害であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 2 2】

前記疾患、障害または状態が、肥満であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 2 3】

前記疾患、障害または状態が、不眠症であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 2 4】

前記疾患、障害または状態が、眠気であるかまたはそれを含む、請求項 9 4 または 9 5 に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項 1 2 5】

患者において、消化管の運動を低下させるための、請求項 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物を含む組成物、または請求項 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 1 2 6】

患者または生物試料において、がん細胞の増殖を低下させる方法において使用するための、請求項 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物を含む組成物、または請求項 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物であって、前記方法は、前記組成物または前記医薬組成物を、前記患者に投与するステップまたは前記生物試料に接触させるステップを含む、組成物または医薬組成物。

【請求項 1 2 7】

患者または生物試料において、脂肪分解を誘導する方法において使用するための、請求項 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物を含む組成物、または請求項 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物であって、前記方法は、前記組成物または前記医薬組成物を、前記患者に投与するステップまたは前記生物試料に接触させるステップを含む、組成物または医薬組成物。

【請求項 1 2 8】

医薬組成物を製造する方法であって、

請求項 1 から 7 3 のいずれかに記載の化合物を少なくとも 1 つの薬学的に許容される担体と一緒に製剤化するステップを含む、方法。

【請求項 1 2 9】

N - アシルエタノールアミド化合物の誘導体を特定する、および / または特徴付ける方法であって、

N - アシルエタノールアミド化合物を修飾するかまたはそれ以外の方法で N - アシルエタノールアミド化合物に連結された X_2 部分を含む誘導体化合物を提供するステップ、

前記誘導体化合物が、前記 N - アシルエタノールアミド化合物に比べて、1 つまたは複数の改善された薬理学的特性を有することを決定するステップを含む、方法。

【請求項 1 3 0】

請求項 1 から 7 3 のいずれかに記載の化合物を製造する方法であって、

N - アシルエタノールアミド化合物（例えば、親 N - アシルエタノールアミド化合物）を、リンカー部分にコンジュゲートするか、またはそれ以外の方法で連結させるステップ、 X_2 部分を前記リンカー - N - アシルエタノールアミド部分にコンジュゲートするか、またはそれ以外の方法で連結させるステップを含む、方法。

【請求項 1 3 1】

請求項 1 から 7 3 のいずれかに記載の化合物を製造する方法であって、

X_2 部分をリンカー部分にコンジュゲートするか、またはそれ以外の方法で連結させるステップ、

N - アシルエタノールアミド化合物（例えば、親 N - アシルエタノールアミド化合物）を前記のリンカー X_2 部分にコンジュゲートするか、またはそれ以外の方法で連結させるステップを含む、方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 7】

とりわけ、本開示は、式 I の化合物および薬学的に許容されるその塩、上記の化合物の調製物、それらを含む医薬およびその製造、ならびに有用なこのような化合物を特定するおよび / または特徴付けるための技術、ならびに例えば、例えば本明細書に記載されている疾患、障害もしくは状態のうちの 1 つまたは複数の処置における提供される化合物の使用を提供する。

特定の実施形態では、例えば以下の項目が提供される。

(項目 1)

式 I - a :

$X_1 - X_2$

の化合物であって、式中、

X_1 は、N - アシルエタノールアミドであり、

X_2 は、前記 N - アシルエタノールアミドにコンジュゲートされた部分である、化合物。

(項目 2)

塩の形態である、項目 1 に記載の化合物。

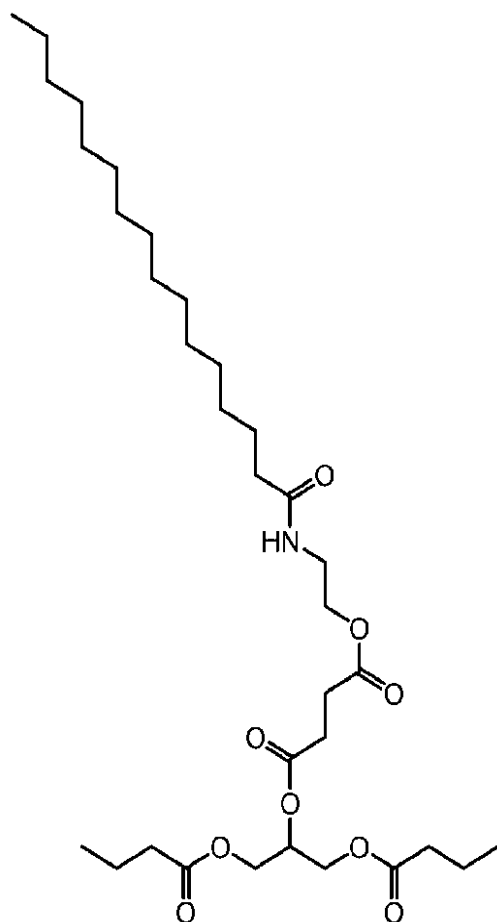
(項目 3)

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、項目 2 に記載の化合物。

(項目 4)

以下：

【化 8 5】

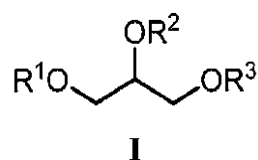


である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 5)

式 I：

【化 8 6】



の化合物であって、式中、

R^1 、 R^2 または R^3 はそれぞれ、独立して、水素または - T - R^4 であり、 R^1 、 R^2 または R^3 のうちの少なくとも 1 つは、- T - R^4 であり、

- T - は、二価部分を表し、

R^4 は、 $C_{1 \sim 40}$ 脂肪族、- C (O) R および X_1 からなる群より選択される、必要に応じて置換された基であり、

R は、水素および必要に応じて置換された $C_{1 \sim 20}$ 脂肪族からなる群より選択され、

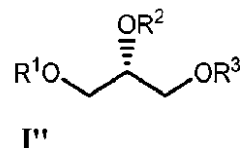
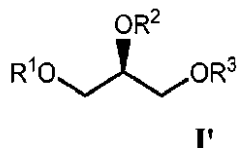
X_1 は、N - アシルエタノールアミドである、

化合物。

(項目 6)

式 I ' または I ''：

【化 8 7】



である、項目 2 に記載の化合物。

(項目 7)

塩の形態である、項目 5 または 6 に記載の化合物。

(項目 8)

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、項目 7 に記載の化合物。

(項目 9)

式 I - b :

$X_1 - X_3$

I - b

の化合物であって、式中、

X_1 は、N - アシルエタノールアミドであり、

X_3 は、 $-(CH_2)_m - P(O)(OR)_2$ 、 C_{1-40} 脂肪族、 $-T-X_4$ からなる群より選択される、必要に応じて置換された基であり、さらに、

m は、0 ~ 10 からなる群より選択される整数であり、

$-T-$ は、二価部分を表し、

X_4 は、糖部分であり、一部の特定の実施形態では、 X_4 は、二糖、例えば、スクロースである、

化合物。

(項目 10)

塩の形態である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 11)

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、項目 10 に記載の化合物。

(項目 12)

X_1 が、N - パルミトイルエタノールアミド、N - オレオイルエタノールアミドおよび N - アラキドノイルエタノールアミドからなる群より選択される、項目 1 から 3 または 9 から 11 のいずれかに記載の化合物。

(項目 13)

X_1 が、N - パルミトイルエタノールアミドである、項目 12 に記載の化合物。

(項目 14)

X_2 が、ホスフェート、酪酸、グリセロール、スクシネート、カプリル酸、グルコン酸、エイコサペンタエン酸、リノール酸、スクシネートおよびスクロースの部分、またはそれらの組み合わせからなる群より選択される部分を含む、項目 1 から 3 のいずれかに記載の化合物。

(項目 15)

R^1 が、 $-T-R^4$ であり、 R^2 および R^3 が水素である、項目 5 から 8 のいずれかに記載の化合物。

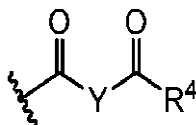
(項目 16)

R^2 が、 $-T-R^4$ であり、 R^1 および R^3 が水素である、項目 5 から 8 のいずれかに記載の化合物。

(項目 17)

R^1 、 R^2 または R^3 のうちの少なくとも 1 つが、

【化 8 8】

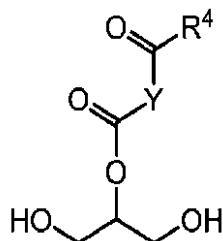


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状 $C_{1 \sim 10}$ 炭化水素鎖である、
項目 5 から 8 または 15 から 16 のいずれかに記載の化合物。

(項目 18)

式 I I :

【化 8 9】

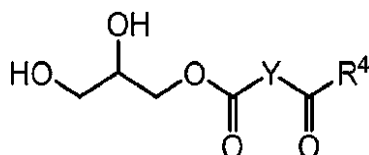


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状 $C_{1 \sim 10}$ 炭化水素鎖である、
項目 17 に記載の化合物。

(項目 19)

式 I I I :

【化 9 0】

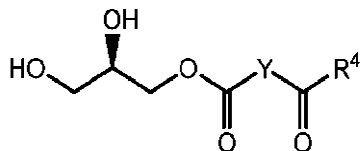


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状 $C_{1 \sim 10}$ 炭化水素鎖である、
項目 17 に記載の化合物。

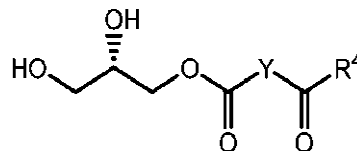
(項目 20)

式 I I I ' または I I I '' :

【化 9 1】



III'



III''

である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 21)

Y が、二価の直鎖または分岐状 $C_{1 \sim 6}$ 炭化水素鎖である、項目 17 から 20 のいずれかに記載の化合物。

(項目 22)

Y が、プロピレンである、項目 21 に記載の化合物。

(項目 23)

Y が、エチレンである、項目 21 に記載の化合物。

(項目 2 4)

Y が、メチレンである、項目 2 1 に記載の化合物。

(項目 2 5)

X₃ が、- (CH₂)_m - PO (OR)₂ である、項目 9 から 1 1 のいずれかに記載の化合物。

(項目 2 6)

X₃ が、- PO (OH)₂ である、項目 2 5 に記載の化合物。

(項目 2 7)

X₃ が、C₁ ~ 4₀ 脂肪族である、項目 9 から 1 1 のいずれかに記載の化合物。

(項目 2 8)

X₃ が、- T - X₄ である、項目 9 から 1 1 のいずれかに記載の化合物。

(項目 2 9)

- T - が、ジカルボン酸から誘導された二価部分である、項目 5 から 1 1 または 1 5 から 1 6 のいずれかに記載の化合物。

(項目 3 0)

- T - が、コハク酸から誘導された二価部分である、項目 2 9 に記載の化合物。

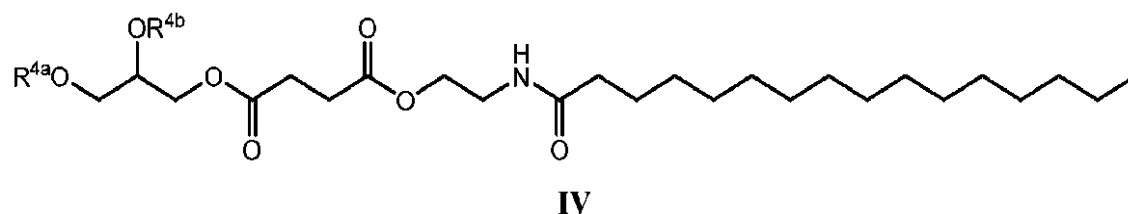
(項目 3 1)

X₄ がスクロースである、項目 9 から 1 1 または 2 8 から 3 0 のいずれかに記載の化合物。

(項目 3 2)

式 I V :

【化 9 2】



であり、式中、

R^{4 a} および R^{4 b} は、独立して、水素、- C (O) R ' または - C (O) - Y - C (O) O R ' であり、

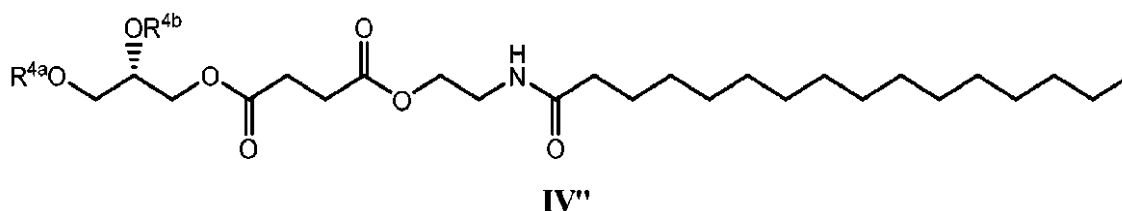
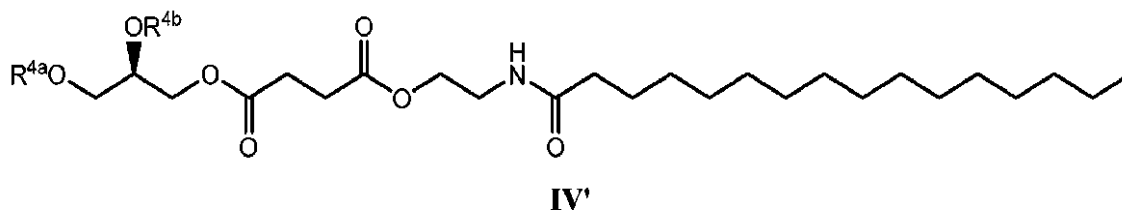
R ' はそれぞれ、水素、および必要に応じて置換された C₁ ~ 2₀ 脂肪族からなる群より独立して選択され、

Y はそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 C₁ ~ 2₀ 炭化水素鎖である、項目 5 に記載の化合物。

(項目 3 3)

式 I V ' または I V '' :

【化 9 3】



である、項目 3 2 に記載の化合物。

(項目 3 4)

塩の形態である、項目 3 2 または 3 3 に記載の化合物。

(項目 3 5)

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、項目 3 4 に記載の化合物。

(項目 3 6)

R^{4a} および R^{4b} が水素である、項目 3 2 から 3 5 のいずれかに記載の化合物。

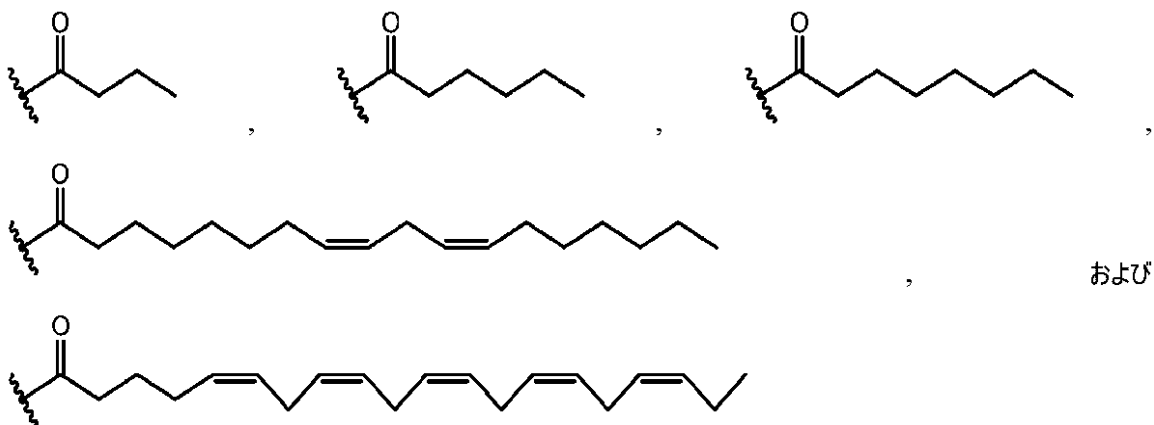
(項目 3 7)

R^{4a} および R^{4b} が独立して、 $-C(O)R'$ である、項目 3 2 から 3 5 のいずれかに記載の化合物。

(項目 3 8)

R^{4a} および R^{4b} が、

【化 9 4】



からなる群より独立して選択される、項目 3 7 に記載の化合物。

(項目 3 9)

R^{4a} および R^{4b} が独立して、 $-C(O)-Y-C(O)OR'$ である、項目 3 2 から 3 5 のいずれかに記載の化合物。

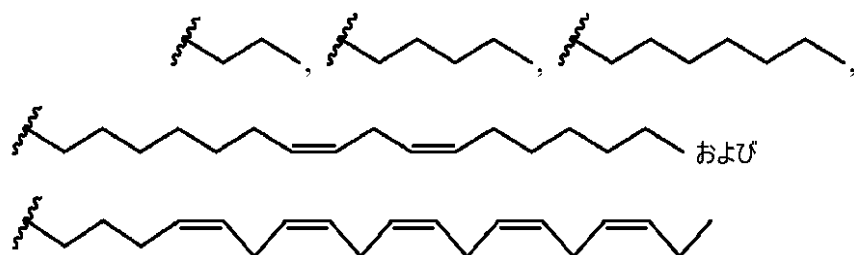
(項目 4 0)

R' が水素である、項目 3 9 に記載の化合物。

(項目 4 1)

R' がそれぞれ、

【化 9 5】



からなる群より独立して選択される、項目 4 0 に記載の化合物。

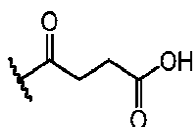
(項目 4 2)

Y がそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 C_{1-6} 炭化水素鎖である、項目 3 9 から 4 1 のいずれかに記載の化合物。

(項目 4 3)

R^{4a} および R^{4b} が、

【化 9 6】

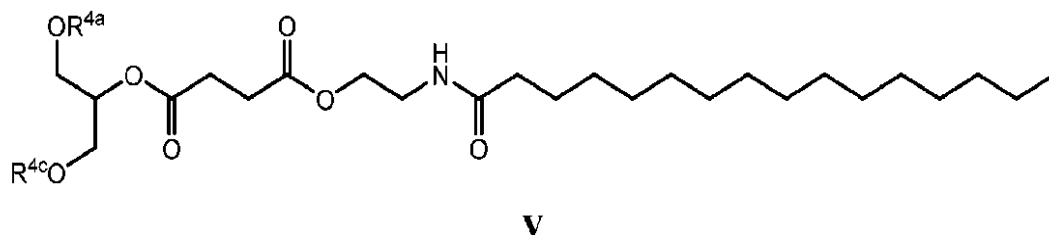


である、項目 3 9 に記載の化合物。

(項目 4 4)

式 V :

【化 9 7】



であり、式中、

R^{4a} および R^{4c} は、独立して、水素、 $-C(O)R'$ または $-C(O)-Y-C(O)OR'$ であり、

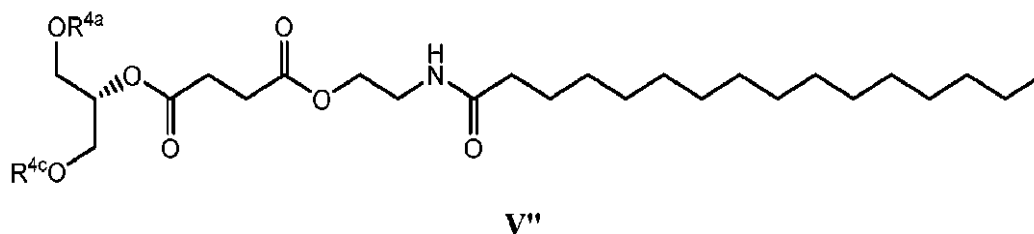
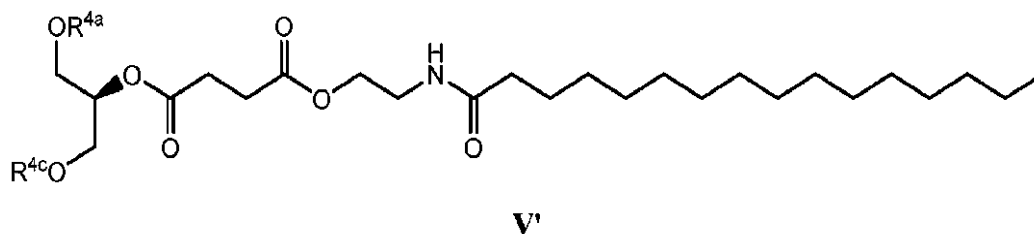
R' はそれぞれ、水素、および必要に応じて置換された C_{1-20} 脂肪族からなる群より独立して選択され、

Y はそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 C_{1-20} 炭化水素鎖である、項目 5 に記載の化合物。

(項目 4 5)

式 V' または V'' :

【化 9 8】



である、項目 4 4 に記載の化合物。

(項目 4 6)

塩の形態である、項目 4 4 または 4 5 に記載の化合物。

(項目 4 7)

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、項目 4 6 に記載の化合物。

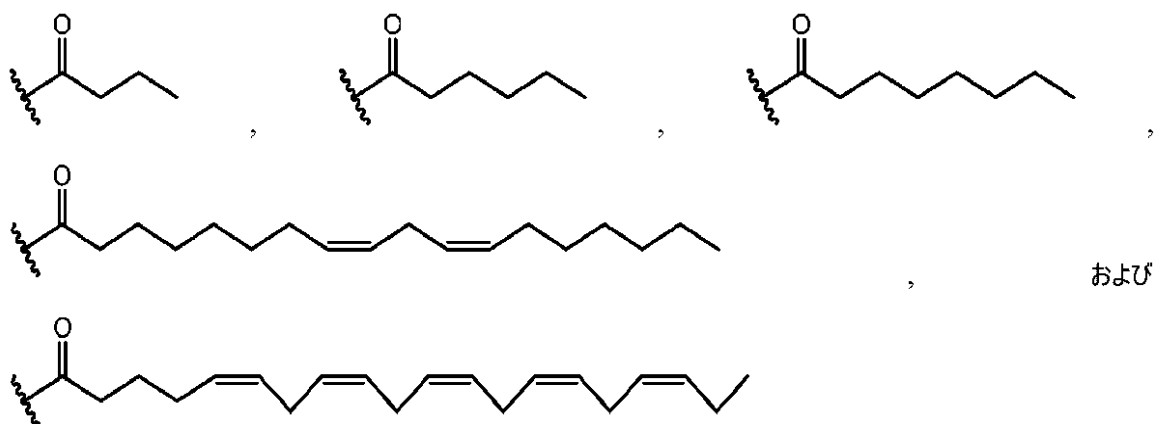
(項目 4 8)

R^{4a} および R^{4c} が水素である、項目 4 4 から 4 7 のいずれかに記載の化合物。

(項目 4 9)

R^{4a} および R^{4c} が、

【化 9 9】



からなる群より独立して選択される、項目 4 4 から 4 7 のいずれかに記載の化合物。

(項目 5 0)

R^{4a} および R^{4c} が独立して、-C(O)-Y-C(O)OR' である、項目 4 4 から 4 7 のいずれかに記載の化合物。

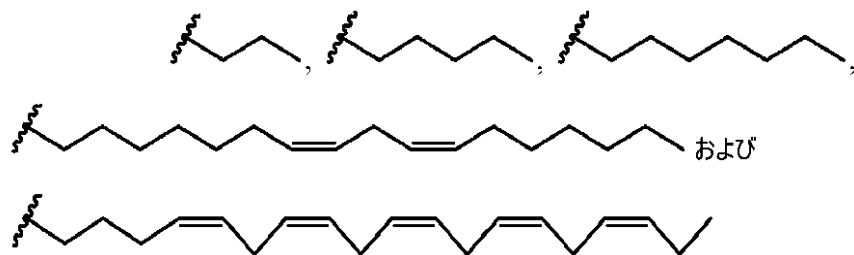
(項目 5 1)

R' が水素である、項目 5 0 に記載の化合物。

(項目 5 2)

R' がそれぞれ、

【化 1 0 0】



からなる群より独立して選択される、項目 5 0 に記載の化合物。

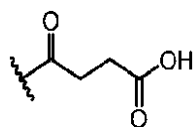
(項目 5 3)

Y がそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 C_{1-6} 炭化水素鎖である、項目 5 0 から 5 2 のいずれかに記載の化合物。

(項目 5 4)

R^{4a} および R^{4c} が、

【化 1 0 1】

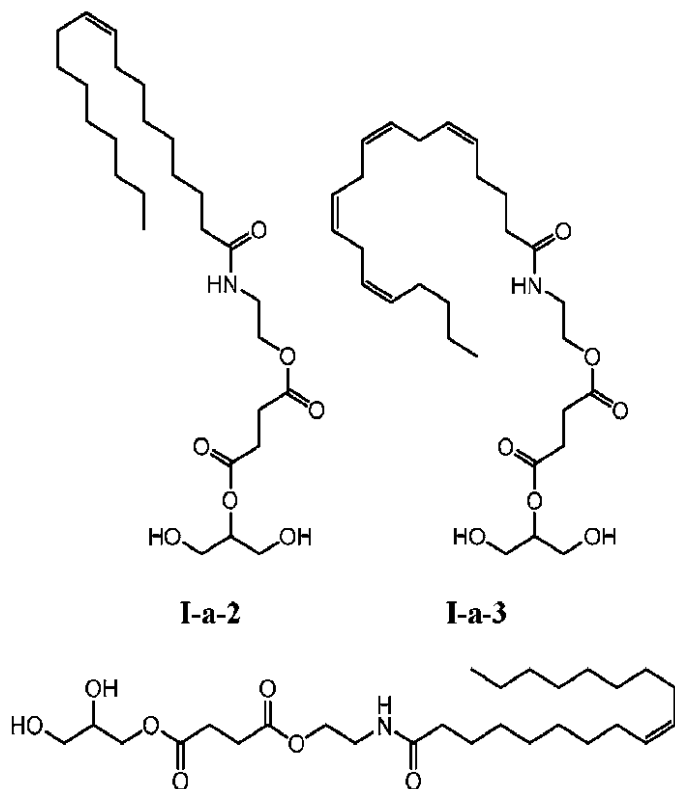


である、項目 5 3 に記載の化合物。

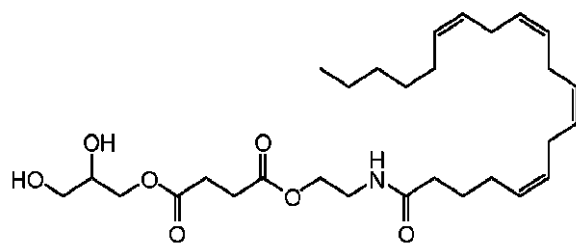
(項目 5 5)

以下：

【化 1 0 2 - 1】



I-a-5

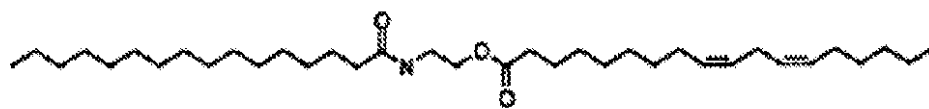
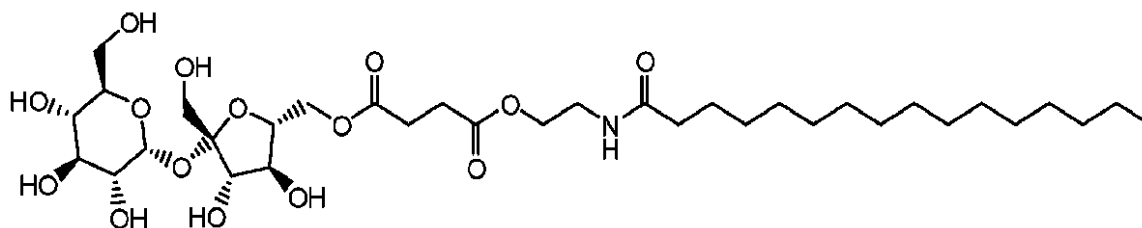
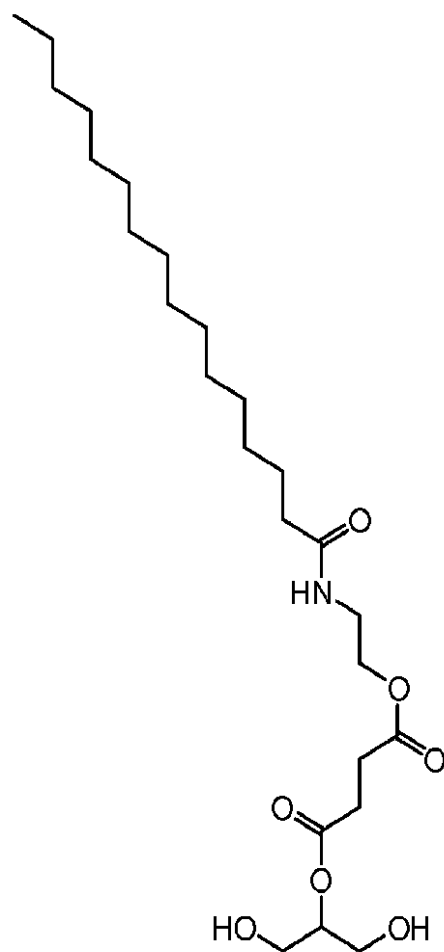
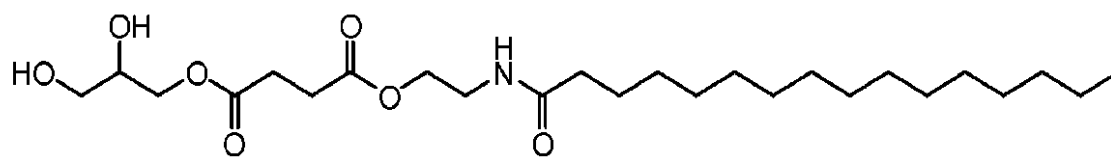
CCCCCCCCCCCCCCCC(=O)NCCOP(=O)(O)OCCCCCCCCCCCCCCCC(=O)NCCOC(=O)CCCC

The chemical structure shows a branched poly(ester amide) (PEA) molecule. It features a central amide group (NH) connected to a long alkyl chain. This central chain is linked via ester groups (O-C=O) to two side chains, each consisting of a long alkyl group and a terminal ester group. The structure is drawn in a zig-zag fashion, representing the polymer backbone and side chains.

CCCCCCCCCCCCCCCC(=O)NCCOC(=O)[C@H](O)[C@@H](O)[C@H](O)[C@@H](O)COCCCCCCCCCCCCCCCC(=O)NCCOC(=O)CCCCC/C=C/C/C=C/C/C=C/C/C=C/C/C=C/C

I-5

【化 1 0 2 - 3】

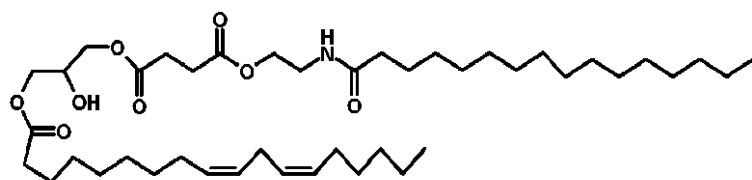
**I-6****I-7****I-8 or****I-9**

から選択される化合物。

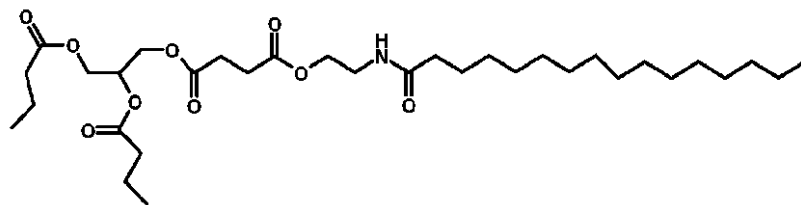
(項目 5 6)

以下：

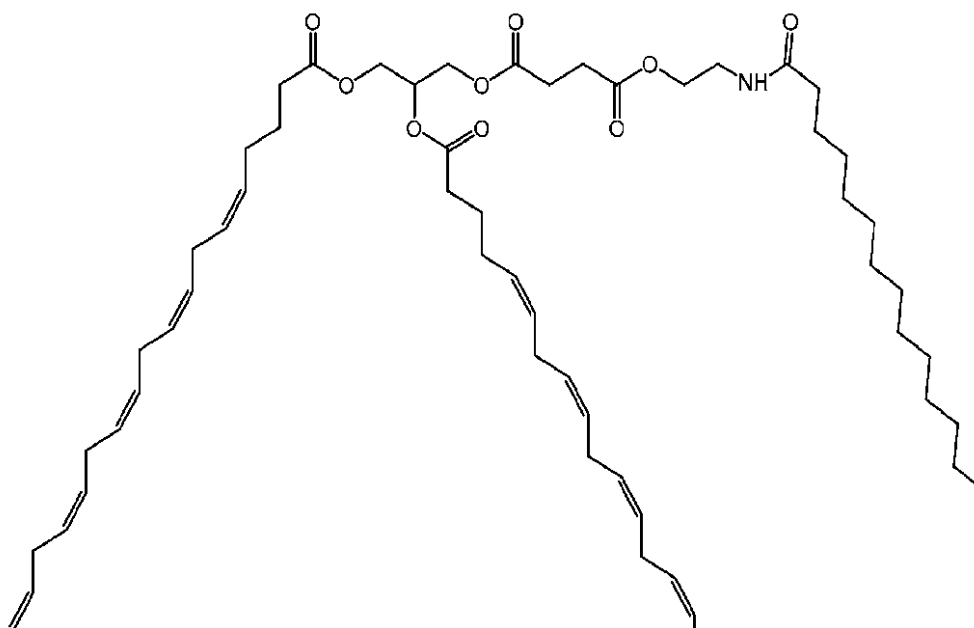
【化 1 0 3 - 1】



I-10

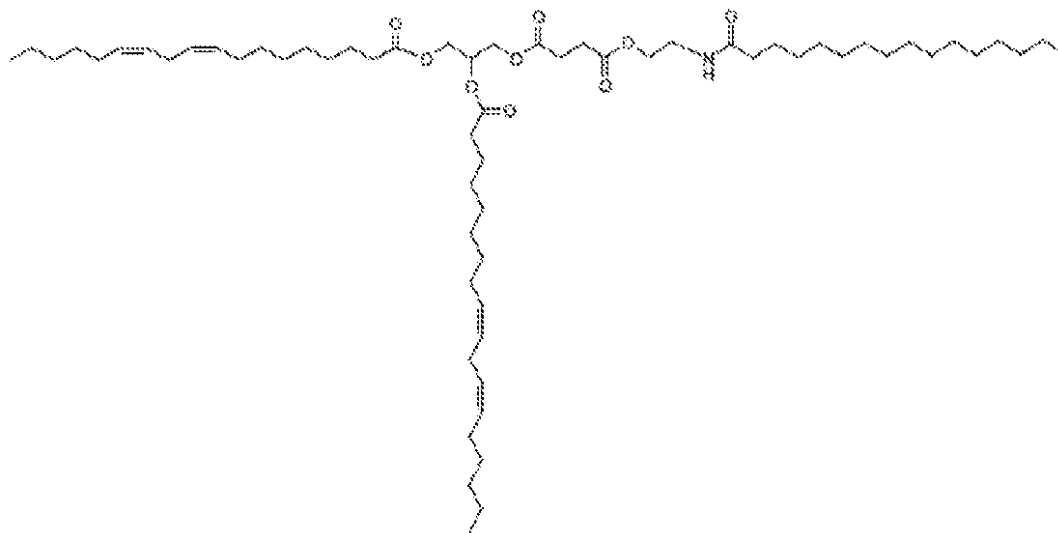
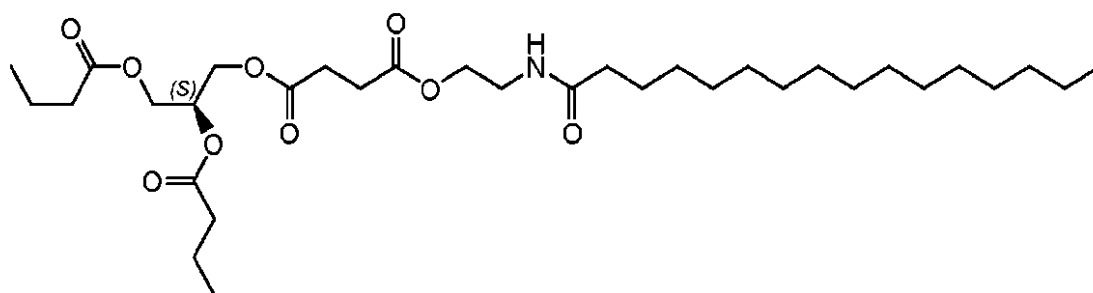
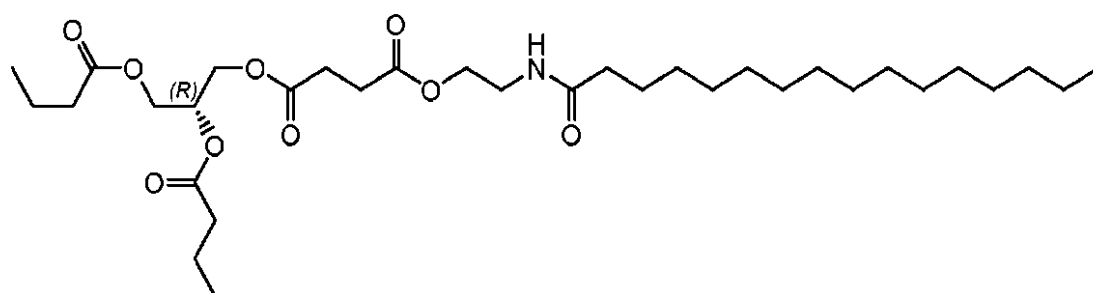


I-11

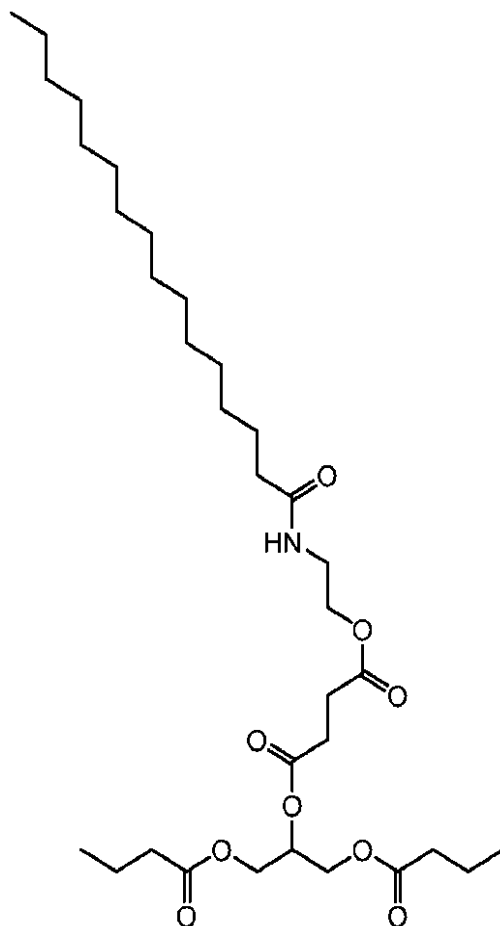


I-12

【化 1 0 3 - 2】

**I-13****I-14****I-15** または

【化 1 0 3 - 3】



I-16

から選択される化合物。

(項目 5 7)

塩の形態である、項目 5 5 または 5 6 に記載の化合物。

(項目 5 8)

前記塩の形態が、薬学的に許容される塩の形態である、項目 5 7 に記載の化合物。

(項目 5 9)

1 個または複数の水素原子が、重水素原子により置き換えられている、前記項目のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 0)

R^1 、 R^2 または R^3 のうちの 1 つまたは複数が、重水素であるか、または重水素を含有する、項目 5 から 8、1 4 から 2 4、および 2 9 から 3 1 のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 1)

N - アシルエタノールアミドである参照化合物と比べて、水性の系での改善された溶解度を示すことができることを特徴とする、前記項目のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 2)

前記参照化合物と比べて、改善された安定性を示すことができることを特徴とする、前記項目のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 3)

前記参照化合物と比べて、異なって代謝されることを特徴とする、前記項目のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 4)

前記参照化合物と比べて、異なる速度で代謝される、項目 6 3 に記載の化合物。

(項目 6 5)

前記参照化合物が、親 N - アシルエタノールアミド化合物である、項目 6 1 から 6 4 のいずれかに記載の化合物。

(項目 6 6)

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - パルミトイルエタノールアミドである、項目 6 5 に記載の化合物。

(項目 6 7)

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - オレオイルエタノールアミドである、項目 6 5 に記載の化合物。

(項目 6 8)

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - アラキドノイルエタノールアミドである、項目 6 5 に記載の化合物。

(項目 6 9)

投与されると、N - アシルエタノールアミド化合物またはその活性代謝産物を送達することを特徴とする、前記項目のいずれかに記載の化合物。

(項目 7 0)

前記 N - アシルエタノールアミド化合物が、親 N - アシルエタノールアミド化合物である、項目 6 9 に記載の化合物。

(項目 7 1)

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - パルミトイルエタノールアミドである、項目 6 9 に記載の化合物。

(項目 7 2)

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - オレオイルエタノールアミドである、項目 6 9 に記載の化合物。

(項目 7 3)

前記親 N - アシルエタノールアミド化合物が、N - アラキドノイルエタノールアミドである、項目 7 0 に記載の化合物。

(項目 7 4)

前記項目のいずれかに記載の構造の化合物および薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

(項目 7 5)

前記医薬組成物が、室温で液体であることを特徴とする、項目 7 4 に記載の医薬組成物。

(項目 7 6)

前記医薬組成物が、経口送達のために製剤化されている、項目 7 4 または 7 5 に記載の医薬組成物。

(項目 7 7)

前記医薬組成物が、固形製剤として製剤化されている、項目 7 6 に記載の医薬組成物。

(項目 7 8)

前記医薬組成物が、液体製剤として製剤化されている、項目 7 7 に記載の医薬組成物。

(項目 7 9)

前記固形製剤が錠剤である、項目 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目 8 0)

前記固形製剤がカプセル剤である、項目 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目 8 1)

前記カプセル剤が、液体を封入している、項目 8 0 に記載の医薬組成物。

(項目 8 2)

前記カプセル剤が、ゲルを封入している、項目 8 0 に記載の医薬製剤。

(項目 8 3)

前記カプセル剤が、固体を封入している、項目 8 0 に記載の医薬製剤。

(項目 8 4)

前記医薬組成物が、液体であるか、または液体を含む、項目 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目 8 5)

前記医薬組成物が、ゲルであるか、またはゲルを含む、項目 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目 8 6)

前記医薬組成物が、シロップであるか、またはシロップを含む、項目 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目 8 7)

前記医薬組成物が、懸濁物であるか、または懸濁物を含む、項目 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目 8 8)

前記医薬組成物が、粉末であるか、または粉末を含む、項目 7 4 から 7 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目 8 9)

前記医薬組成物が、局所送達のために製剤化されている、項目 7 4 に記載の医薬組成物。

(項目 9 0)

前記医薬組成物が、クリーム剤として製剤化されている、項目 7 4 から 7 8、または 8 9 のいずれかに記載の医薬製剤。

(項目 9 1)

前記医薬組成物が、軟膏剤として製剤化されている、項目 7 4 から 7 8、または 8 9 のいずれかに記載の医薬製剤。

(項目 9 2)

前記医薬組成物が、泡沫として製剤化されている、項目 7 4 から 7 8、または 8 9 のいずれかに記載の医薬製剤。

(項目 9 3)

被験体に経口投与されると、生物学的に活性な N - アシルエタノールアミド化合物、または生物学的に活性なその代謝産物を、前記 N - アシルエタノールアミド化合物の同等な参照医薬組成物によって達成される経口バイオアベイラビリティよりも高い経口バイオアベイラビリティで送達することを特徴とする、項目 1 から 7 3 に記載の化合物、または項目 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目 9 4)

疾患、障害または状態に罹患している、またはそれらに罹患し易い被験体を処置する方法であって、

前記被験体に、項目 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物、または項目 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物を投与するステップを含む、方法。

(項目 9 5)

前記化合物または医薬組成物が、前記被験体が罹患している前記疾患、障害もしくは状態、またはそれらの 1 つまたは複数の症状を処置する 1 つまたは複数の他の薬剤と組み合わせ投与される、項目 9 4 に記載の方法。

(項目 9 6)

前記疾患、障害または状態が、疼痛であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 9 7)

前記疾患、障害または状態が、慢性下部背痛であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 9 8)

前記疾患、障害または状態が、坐骨神経痛であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 9 9)

前記疾患、障害または状態が、神経根障害であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 0)

前記疾患、障害または状態が、放散痛であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 1)

前記疾患、障害または状態が、不安であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 2)

前記疾患、障害または状態が、うつ病であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 3)

前記疾患、障害または状態が、統合失調症の 1 つまたは複数の症状を特徴とする、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 4)

前記疾患、障害または状態が、筋萎縮性側索硬化症であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 5)

前記疾患、障害または状態が、多発性硬化症であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 6)

前記疾患、障害または状態が、神経学的疾患、障害または状態であるかまたはそれらを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 7)

前記疾患、障害または状態が、パーキンソン病であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 8)

前記疾患、障害または状態が、アルツハイマー病であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 0 9)

前記疾患、障害または状態が、ハンチントン病であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 0)

前記疾患、障害または状態が、神経障害性疼痛であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 1)

前記疾患、障害または状態が、脳虚血であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 2)

前記疾患、障害または状態が、てんかんであるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 3)

前記疾患、障害または状態が、食欲喪失であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 4)

前記疾患、障害または状態が、歯痛であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 5)

前記疾患、障害または状態が、変形性関節症であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 6)

前記疾患、障害または状態が、消化管の運動の低下であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 7)

前記疾患、障害または状態が、がんであるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 8)

前記疾患、障害または状態が、緑内障であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 1 9)

前記疾患、障害または状態が、アトピー性皮膚炎であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 2 0)

前記疾患、障害または状態が、呼吸器感染であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 2 1)

前記疾患、障害または状態が、心的外傷後ストレス障害であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 2 2)

前記疾患、障害または状態が、肥満であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 2 3)

前記疾患、障害または状態が、不眠症であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 2 4)

前記疾患、障害または状態が、眠気であるかまたはそれを含む、項目 9 4 または 9 5 に記載の方法。

(項目 1 2 5)

患者において、消化管の運動を低下させる方法であって、前記患者に、項目 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物、または項目 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物を投与するステップを含む、方法。

(項目 1 2 6)

患者または生物試料において、がん細胞の増殖を低下させる方法であって、項目 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物、または項目 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物を、前記患者に投与するステップまたは前記生物試料に接触させるステップを含む、方法。

(項目 1 2 7)

患者または生物試料において、脂肪分解を誘導する方法であって、項目 1 から 7 3 のいずれかに記載の構造の化合物、または項目 7 4 から 9 2 のいずれかに記載の医薬組成物を、前記患者に投与するステップまたは前記生物試料に接触させるステップを含む、方法。

(項目 1 2 8)

医薬組成物を製造する方法であって、
項目 1 から 7 3 のいずれかに記載の化合物を少なくとも 1 つの薬学的に許容される担体と一緒に製剤化するステップを含む、方法。

(項目 1 2 9)

N - アシルエタノールアミド化合物の誘導体を特定する、および / または特徴付ける方法であって、

N - アシルエタノールアミド化合物を修飾するかまたはそれ以外の方法で N - アシルエタノールアミド化合物に連結された X₂ 部分を含む誘導体化合物を提供するステップ、

前記誘導体化合物が、前記 N - アシルエタノールアミド化合物に比べて、1 つまたは複数の改善された薬理学的特性を有することを決定するステップを含む、方法。

(項目 1 3 0)

項目 1 から 7 3 のいずれかに記載の化合物を製造する方法であって、

N - アシルエタノールアミド化合物 (例えば、親 N - アシルエタノールアミド化合物) を、リンカー部分にコンジュゲートするか、またはそれ以外の方法で連結させるステップ、X₂ 部分を前記リンカー - N - アシルエタノールアミド部分にコンジュゲートするか、またはそれ以外の方法で連結させるステップ

を含む、方法。

(項目 1 3 1)

項目 1 から 7 3 のいずれかに記載の化合物を製造する方法であって、

X₂ 部分をリンカー部分にコンジュゲートするか、またはそれ以外の方法で連結させるステップ、

N - アシルエタノールアミド化合物 (例えば、親 N - アシルエタノールアミド化合物) を前記のリンカー X₂ 部分にコンジュゲートするか、またはそれ以外の方法で連結させるステップ

を含む、方法。