

【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 07 C 233/18 (2006.01)  
A 61 K 47/54 (2017.01)  
A 61 K 31/225 (2006.01)  
A 61 K 31/22 (2006.01)  
C 07 H 15/04 (2006.01)  
A 61 K 31/7028 (2006.01)  
A 61 K 31/661 (2006.01)  
A 61 K 9/08 (2006.01)  
A 61 K 9/20 (2006.01)  
A 61 K 9/48 (2006.01)  
A 61 K 9/06 (2006.01)  
A 61 K 9/10 (2006.01)  
A 61 K 9/14 (2006.01)  
A 61 K 9/107 (2006.01)  
A 61 K 9/12 (2006.01)  
A 61 P 25/04 (2006.01)  
A 61 P 25/22 (2006.01)  
A 61 P 25/24 (2006.01)  
A 61 P 25/18 (2006.01)  
A 61 P 21/02 (2006.01)  
A 61 P 25/00 (2006.01)  
A 61 P 25/16 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 P 25/14 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 25/08 (2006.01)  
A 61 P 1/00 (2006.01)  
A 61 P 1/02 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 27/06 (2006.01)  
A 61 P 37/08 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (2006.01)  
A 61 P 11/00 (2006.01)  
A 61 P 3/04 (2006.01)  
A 61 P 25/20 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
C 07 C 233/20 (2006.01)  
C 07 F 9/09 (2006.01)

【F I】

C 07 C 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<sub>1</sub> - X<sub>2</sub>

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。

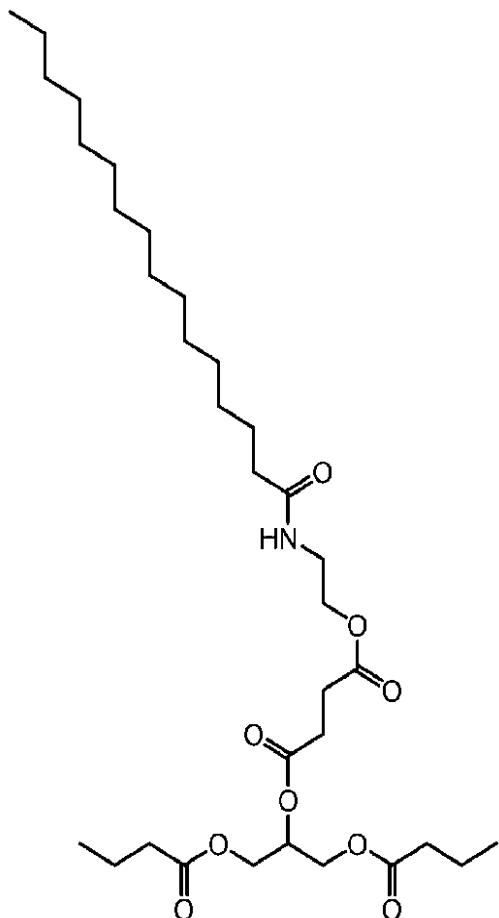
【請求項3】

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85】

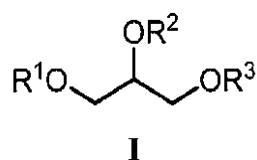


である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

式I：

【化86】



の化合物であって、式中、

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

$-\text{T}-$ は、二価部分を表し、



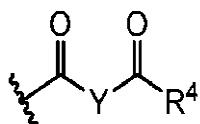
## 【請求項 16】

$R^2$  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 8 8】

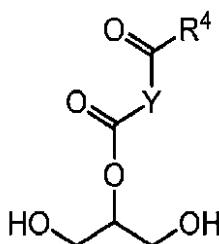


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状  $C_{1 \sim 10}$  炭化水素鎖である、請求項 5 から 8 または 15 から 16 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 18】

式 I I :

## 【化 8 9】

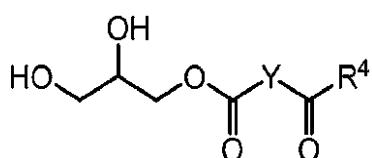


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状  $C_{1 \sim 10}$  炭化水素鎖である、請求項 17 に記載の化合物。

## 【請求項 19】

式 I I I :

## 【化 9 0】

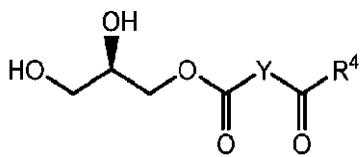


であり、式中、Y は、二価の直鎖または分岐状  $C_{1 \sim 10}$  炭化水素鎖である、請求項 17 に記載の化合物。

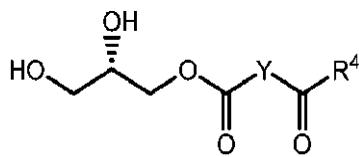
## 【請求項 20】

式 I I I ' または I I I " :

## 【化 9 1】



III'



III"

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  $C_{1 \sim 6}$  炭化水素鎖である、請求項 17 から 20 のいず

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】

X<sub>3</sub> が、- (C H<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - P O (O R)<sub>2</sub> 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】

X<sub>3</sub> が、- P O (O H)<sub>2</sub> である、請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

X<sub>3</sub> が、C<sub>1</sub> ~ <sub>4</sub> <sub>0</sub> 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】

X<sub>3</sub> が、- T - X<sub>4</sub> 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。

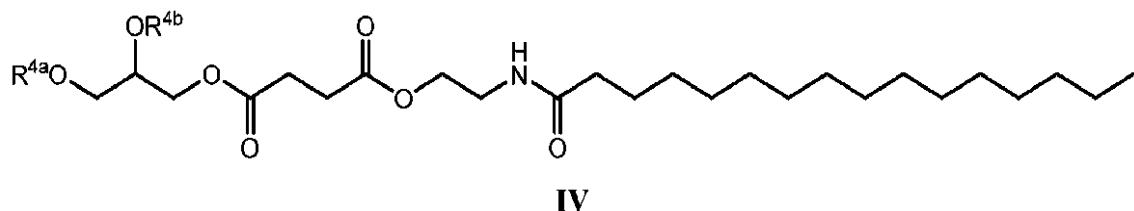
【請求項 3 1】

X<sub>4</sub> 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<sup>4 a</sup> および R<sup>4 b</sup> は、独立して、水素、- C (O) R' または - C (O) - Y - C (O) O R' であり、

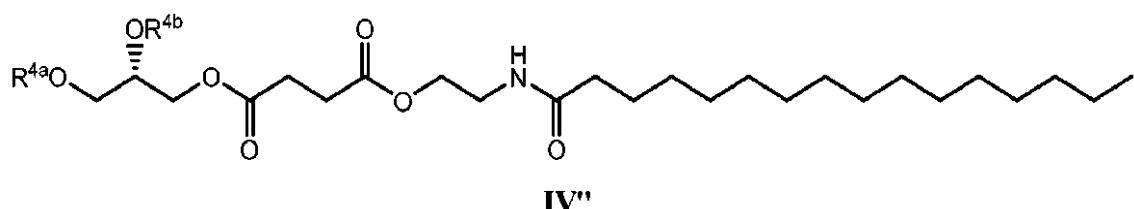
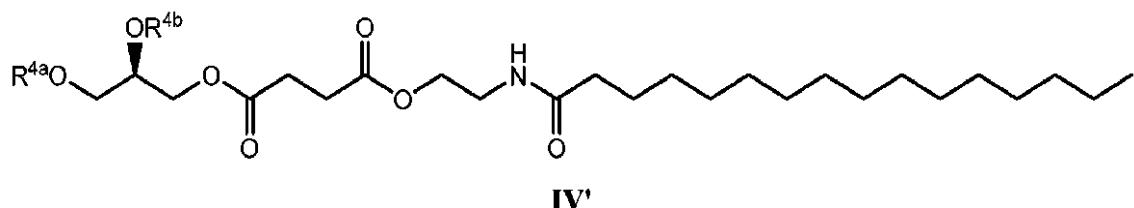
R' はそれぞれ、水素、および必要に応じて置換された C<sub>1</sub> ~ <sub>2</sub> <sub>0</sub> 脂肪族からなる群より独立して選択され、

Y はそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 C<sub>1</sub> ~ <sub>2</sub> <sub>0</sub> 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93】



である、請求項32に記載の化合物。

## 【請求項34】

塩の形態である、請求項32または33に記載の化合物。

## 【請求項35】

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34に記載の化合物。

## 【請求項36】

$R^{4a}$ および $R^{4b}$ が水素である、請求項32から35のいずれかに記載の化合物。

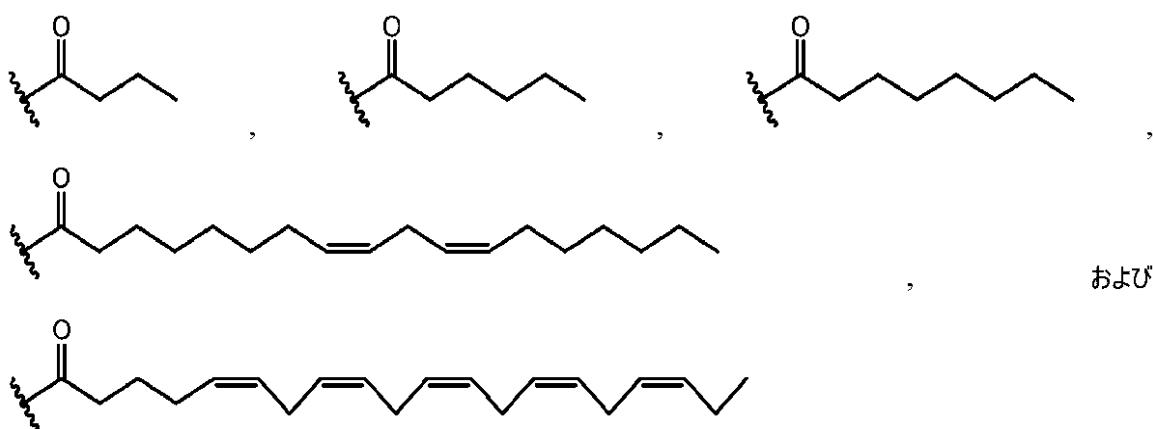
## 【請求項37】

$R^{4a}$ および $R^{4b}$ が独立して、 $-C(O)R'$ である、請求項32から35のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項38】

$R^{4a}$ および $R^{4b}$ が、

## 【化94】



からなる群より独立して選択される、請求項37に記載の化合物。

## 【請求項39】

$R^{4a}$ および $R^{4b}$ が独立して、 $-C(O)-Y-C(O)OR'$ である、請求項32から35のいずれかに記載の化合物。

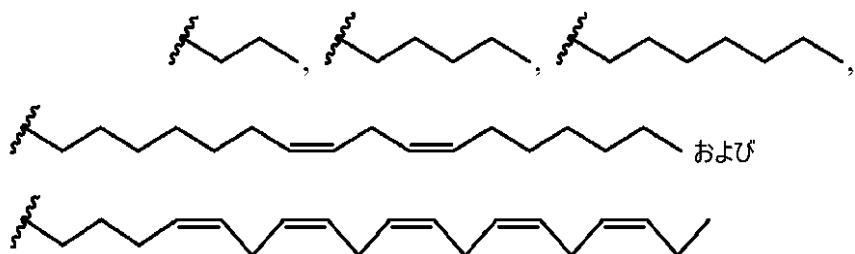
## 【請求項40】

$R'$ が水素である、請求項39に記載の化合物。

## 【請求項41】

$R'$ がそれぞれ、

## 【化95】



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。

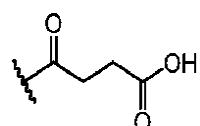
## 【請求項42】

Yがそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>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43】

R<sup>4a</sup>およびR<sup>4b</sup>が、

## 【化96】

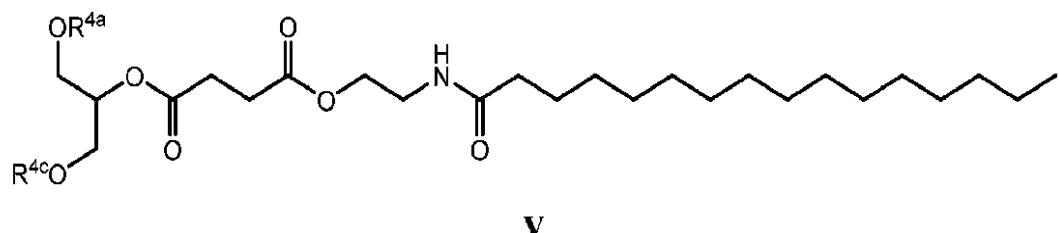


である、請求項39に記載の化合物。

## 【請求項44】

式V:

## 【化97】



であり、式中、

R<sup>4a</sup>およびR<sup>4c</sup>は、独立して、水素、-C(O)R'または-C(O)-Y-C(O)OR'であり、

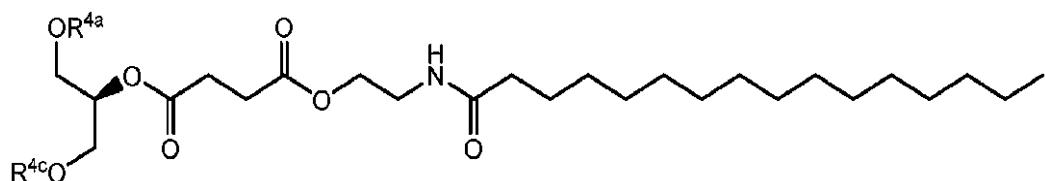
R'はそれぞれ、水素、および必要に応じて置換されたC<sub>1</sub>~<sub>20</sub>脂肪族からなる群より独立して選択され、

Yはそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub>~<sub>20</sub>炭化水素鎖である、請求項5に記載の化合物。

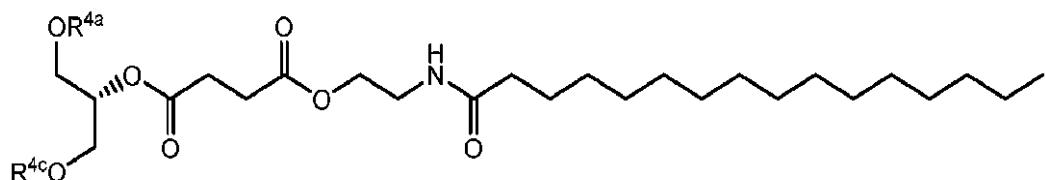
## 【請求項45】

式V'またはV'':

## 【化98】



V'



V''

である、請求項44に記載の化合物。

## 【請求項46】

塩の形態である、請求項44または45に記載の化合物。

## 【請求項47】

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46に記載の化合物。

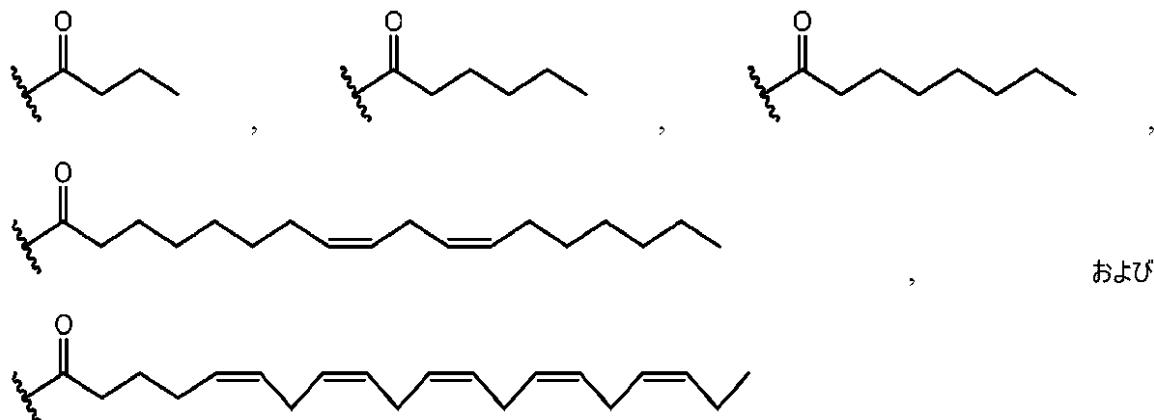
## 【請求項48】

R<sup>4a</sup>およびR<sup>4c</sup>が水素である、請求項44から47のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項49】

R<sup>4a</sup>およびR<sup>4c</sup>が、

## 【化99】



からなる群より独立して選択される、請求項44から47のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項50】

R<sup>4a</sup>およびR<sup>4c</sup>が独立して、-C(O)-Y-C(O)OR'である、請求項44から47のいずれかに記載の化合物。

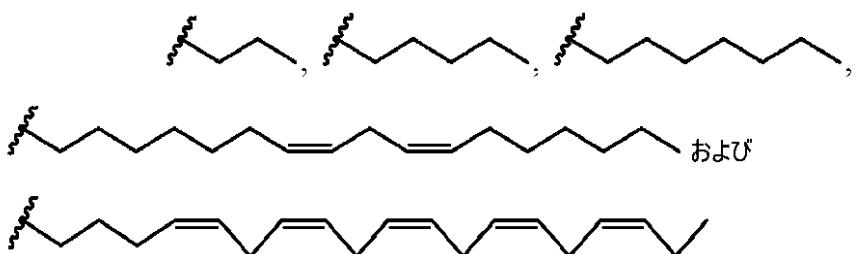
## 【請求項51】

R'が水素である、請求項50に記載の化合物。

## 【請求項52】

R'がそれぞれ、

【化100】



からなる群より独立して選択される、請求項 50 に記載の化合物。

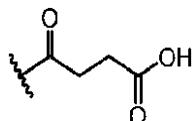
【請求項 53】

Y がそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状 C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> 炭化水素鎖である、請求項 50 から 52 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 54】

R<sup>4-a</sup> および R<sup>4-c</sup> が、

【化101】

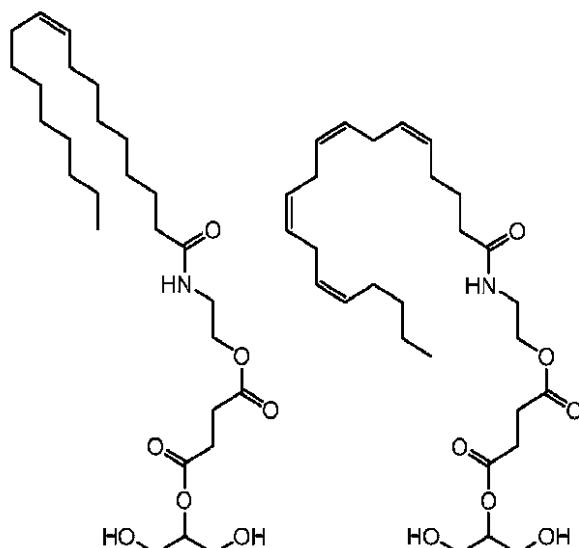


である、請求項 53 に記載の化合物。

【請求項 55】

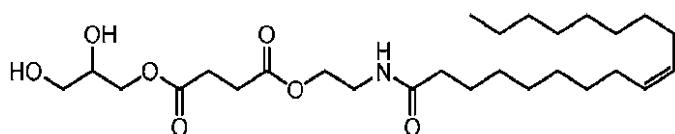
以下：

【化102-1】

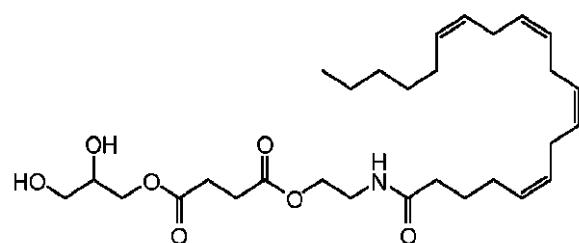
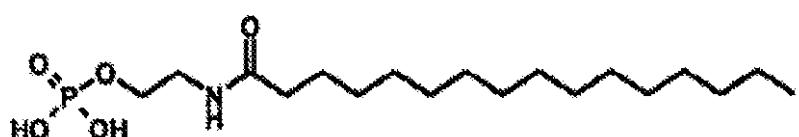
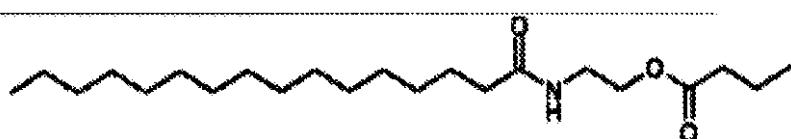
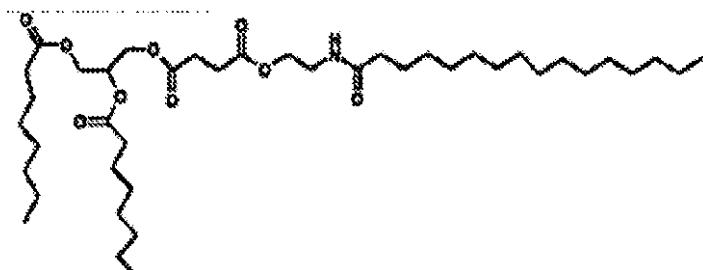
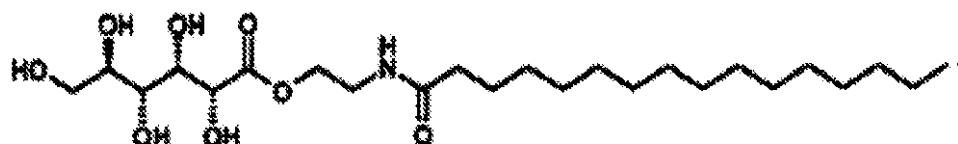
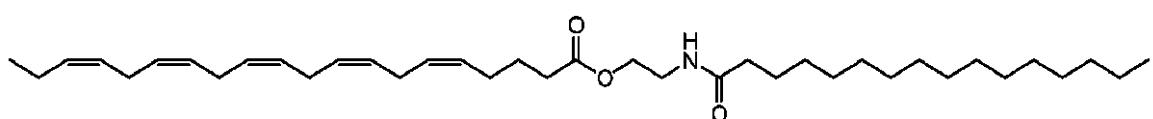


I-a-2

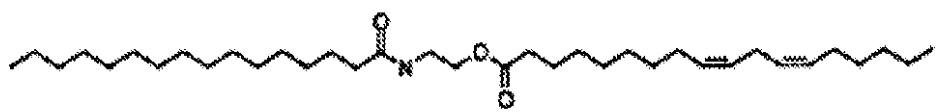
I-a-3



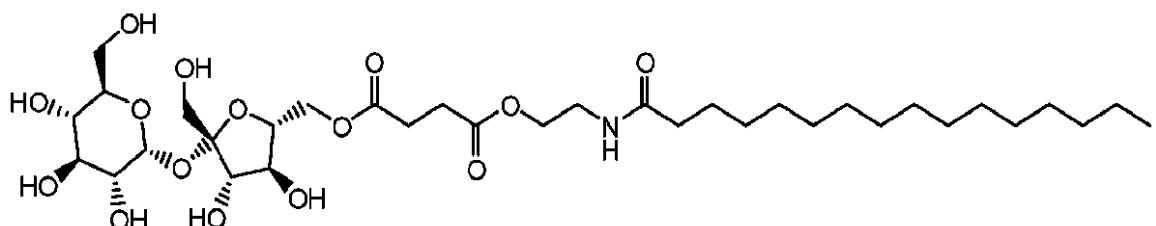
【化 1 0 2 - 2】

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

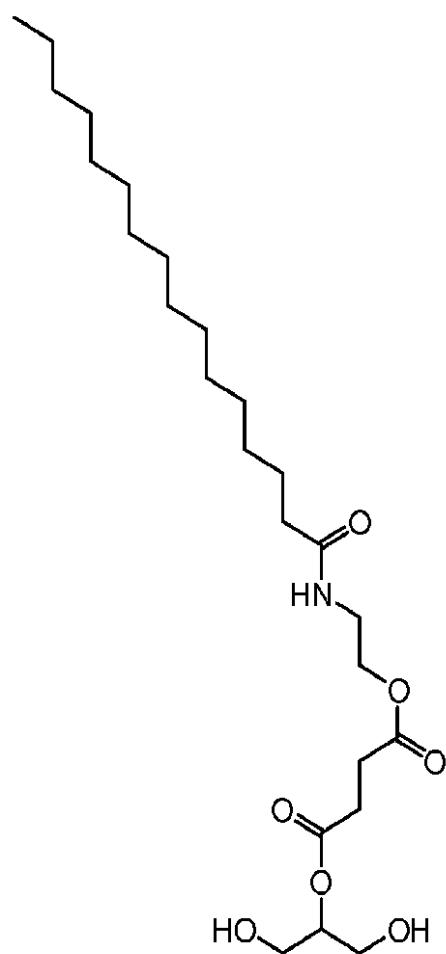
【化 1 0 2 - 3 】



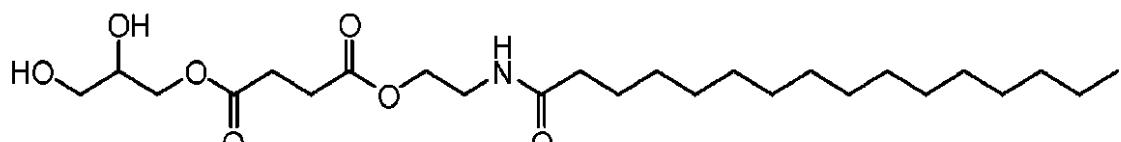
I-6



I-7



I-8 or



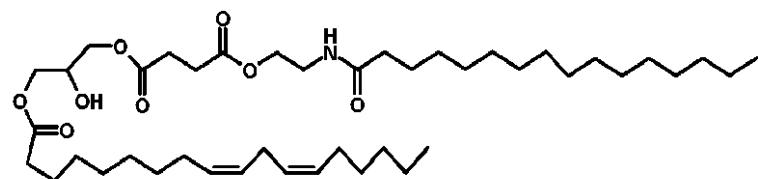
I-9

から選択される化合物。

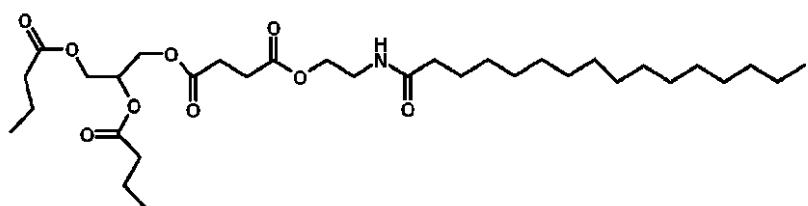
【請求項 5 6】

以下：

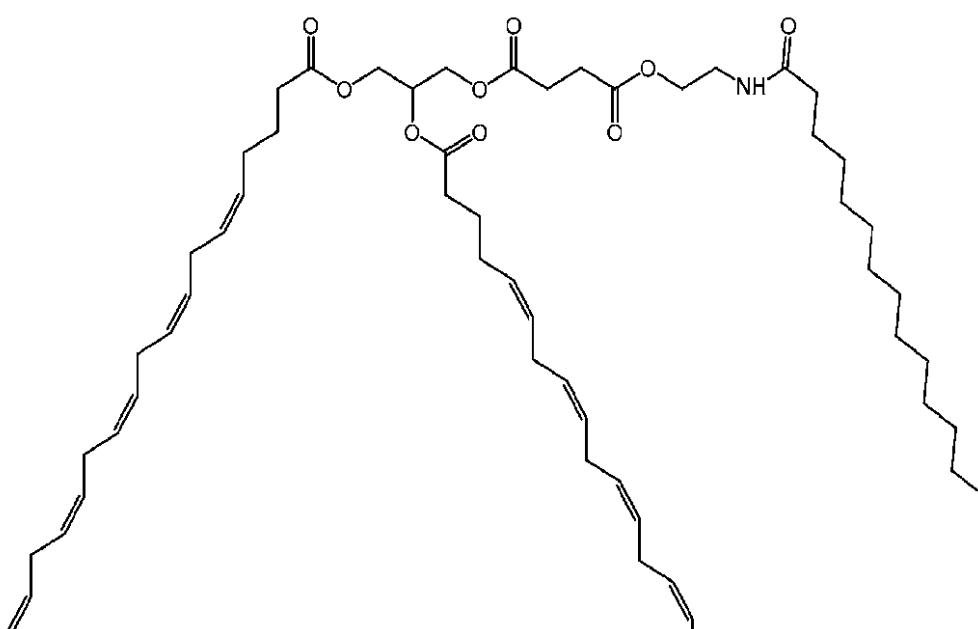
【化 1 0 3 - 1】



I-10

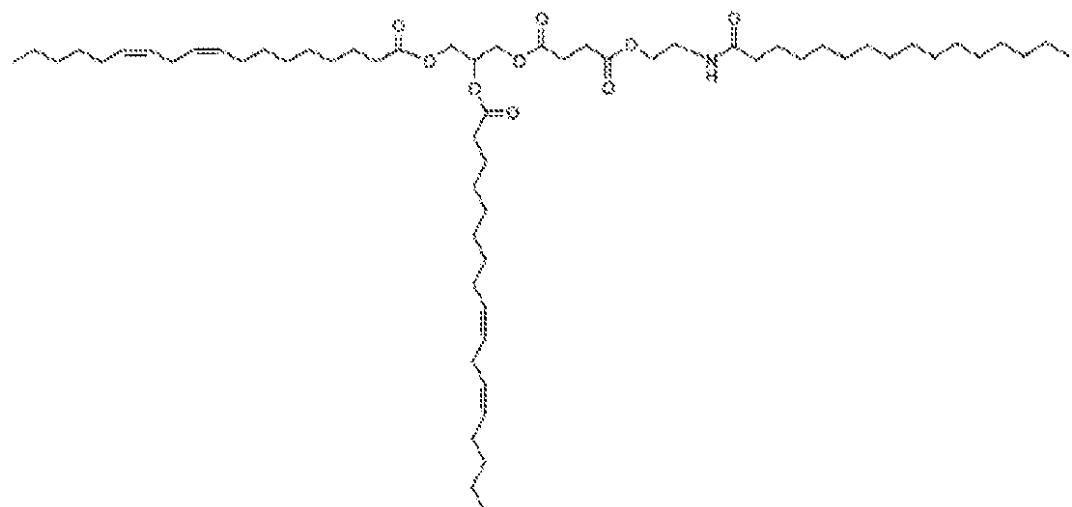


I-11

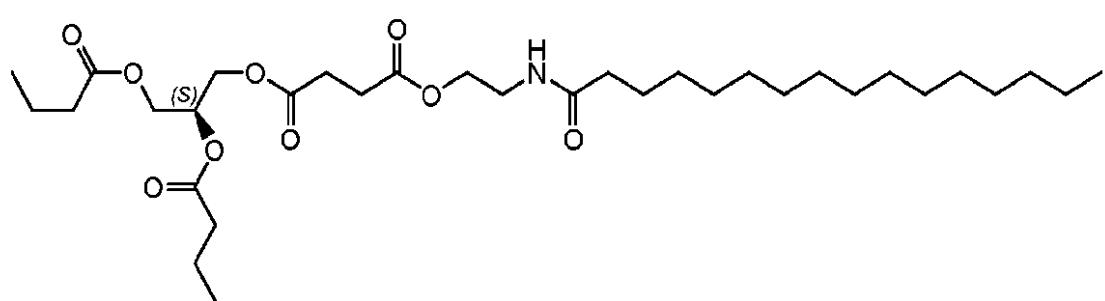


I-12

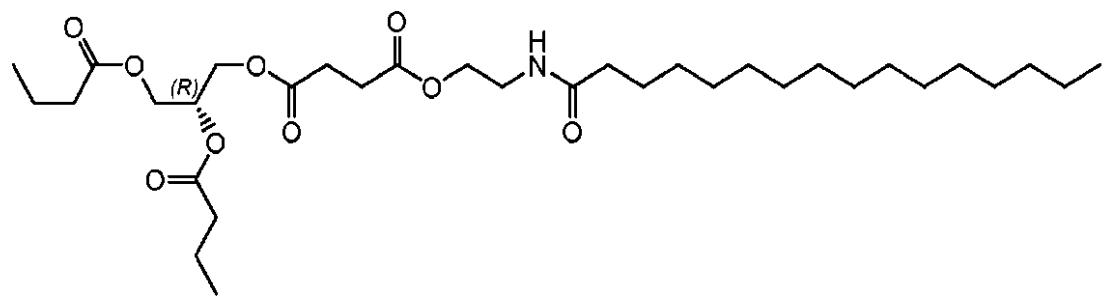
【化 1 0 3 - 2】



I-13

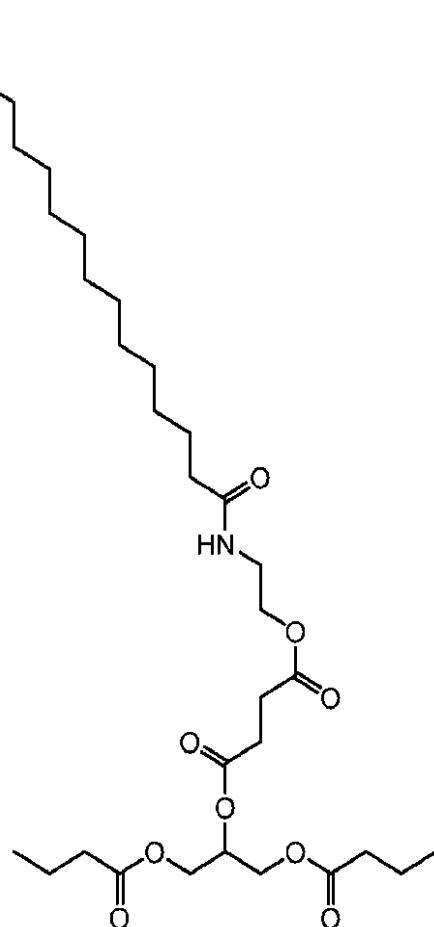


I-14



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 、 14 から 24 、および 29 から 31 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、固体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】

前記固体製剤が錠剤である、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】

前記固体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させて投与される、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、縁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<sub>2</sub> 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<sub>2</sub> 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<sub>2</sub> 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<sub>2</sub> 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、それらを含有する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<sub>1</sub> - X<sub>2</sub>

の化合物であって、式中、

X<sub>1</sub> は、N - アシルエタノールアミドであり、

X<sub>2</sub> 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)

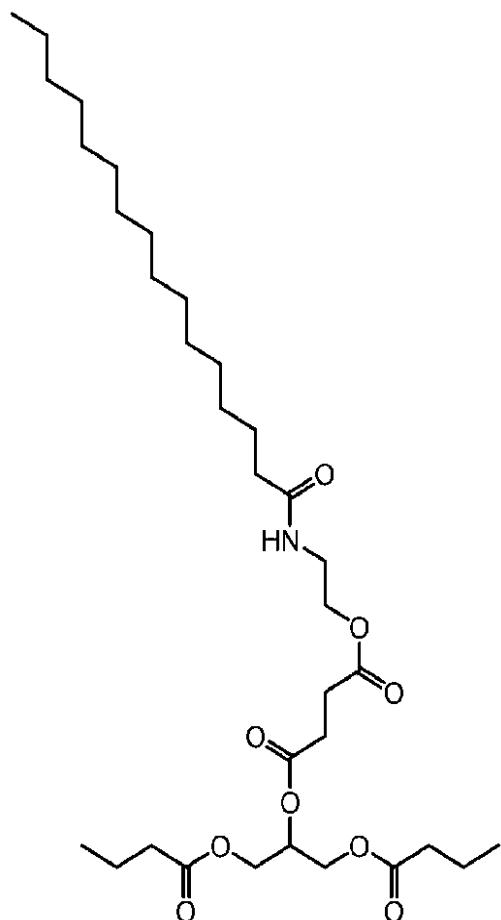
塩の形態である、項目 1 に記載の化合物。

(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】

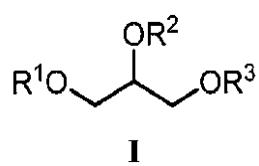


である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 5)

式 I :

【化 8 6】



の化合物であって、式中、

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

- T - は、二価部分を表し、

R<sup>4</sup> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub> 脂肪族、- C(O)R および X<sub>1</sub> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub> 脂肪族からなる群より選択され、

X<sub>1</sub> は、N - アシルエタノールアミドである、

化合物。

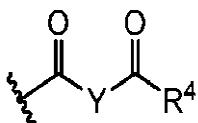
(項目 6)

式 I' または I" :

【化87】

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<sub>1</sub>-X<sub>3</sub>I-bの化合物であって、式中、X<sub>1</sub>は、N-アシルエタノールアミドであり、X<sub>3</sub>は、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-P(0)(OR)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>~<sub>40</sub>脂肪族、-T-X<sub>4</sub>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<sub>4</sub>は、糖部分であり、一部の特定の実施形態では、X<sub>4</sub>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<sub>1</sub>が、N-パルミトイー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<sub>1</sub>が、N-パルミトイー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<sub>2</sub>が、ホスフェート、酪酸、グリセロール、スクシネート、カブリル酸、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<sup>1</sup>が、-T-R<sup>4</sup>であり、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>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<sup>2</sup>が、-T-R<sup>4</sup>であり、R<sup>1</sup>およびR<sup>3</sup>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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>またはR<sup>3</sup>のうちの少なくとも1つが、

【化 8 8】

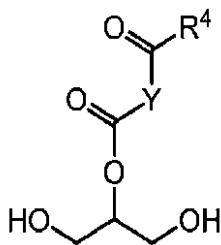


であり、式中、Yは、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>炭化水素鎖である、  
項目5から8または15から16のいずれかに記載の化合物。

(項目18)

式 I I :

【化 8 9】

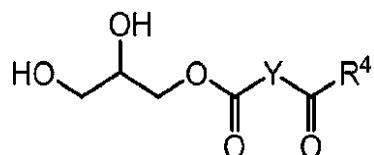


であり、式中、Yは、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>炭化水素鎖である、  
項目17に記載の化合物。

(項目19)

式 I I I :

【化 9 0】

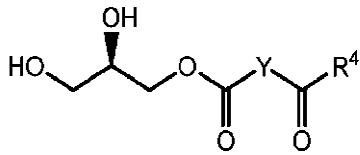


であり、式中、Yは、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>炭化水素鎖である、  
項目17に記載の化合物。

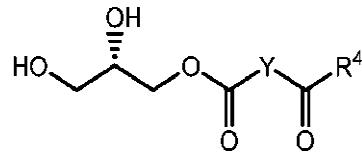
(項目20)

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<sub>1</sub>～<sub>6</sub>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24)

Yが、メチレンである、項目21に記載の化合物。

## (項目25)

X<sub>3</sub>が、- (C<sub>2</sub>H<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - PO(OR)<sub>2</sub>である、項目9から11のいずれかに記載の化合物。

## (項目26)

X<sub>3</sub>が、- PO(OH)<sub>2</sub>である、項目25に記載の化合物。

## (項目27)

X<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub> ~ <sub>4</sub> <sub>0</sub> 脂肪族である、項目9から11のいずれかに記載の化合物。

## (項目28)

X<sub>3</sub>が、- T - X<sub>4</sub>である、項目9から11のいずれかに記載の化合物。

## (項目29)

- 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11または15から16のいずれかに記載の化合物。

## (項目30)

- T - が、コハク酸から誘導された二価部分である、項目29に記載の化合物。

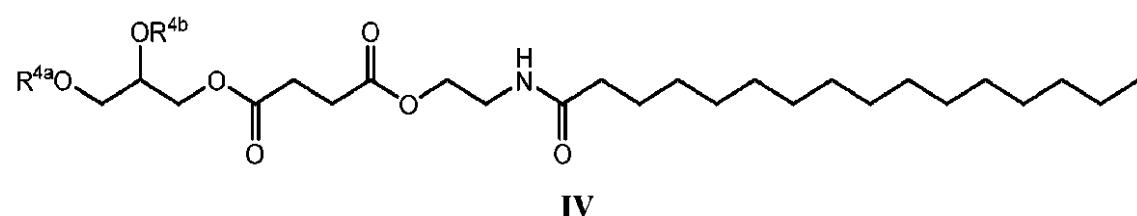
## (項目31)

X<sub>4</sub>がスクロースである、項目9から11または28から30のいずれかに記載の化合物。

## (項目32)

式IV:

## 【化92】



であり、式中、

R<sup>4a</sup>およびR<sup>4b</sup>は、独立して、水素、- C(O)R'または- C(O) - Y - C(O)OR'であり、

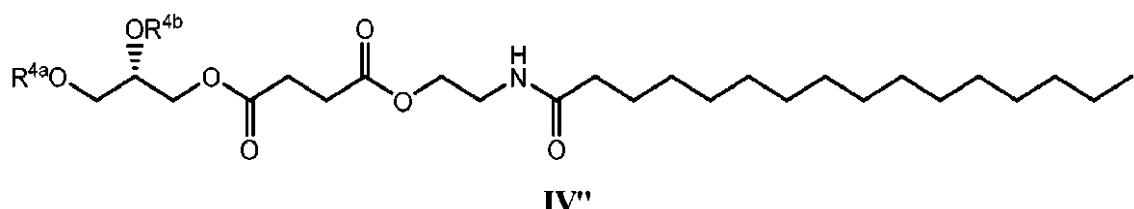
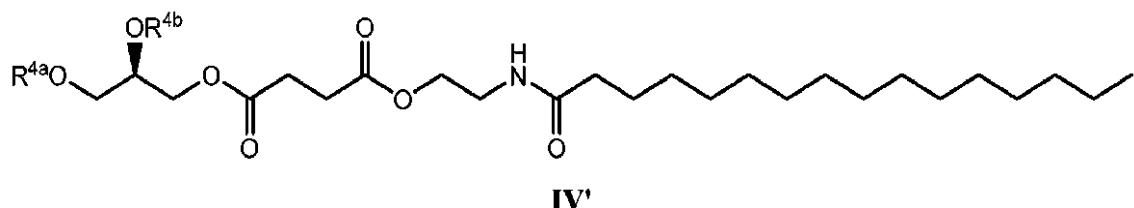
R'はそれぞれ、水素、および必要に応じて置換されたC<sub>1</sub> ~ <sub>2</sub> <sub>0</sub> 脂肪族からなる群より独立して選択され、

Yはそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub> ~ <sub>2</sub> <sub>0</sub> 炭化水素鎖である、項目5に記載の化合物。

## (項目33)

式IV'またはIV" :

## 【化93】



である、項目32に記載の化合物。

(項目34)

塩の形態である、項目32または33に記載の化合物。

(項目35)

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34に記載の化合物。

(項目36)

$R^{4a}$ および $R^{4b}$ が水素である、項目32から35のいずれかに記載の化合物。

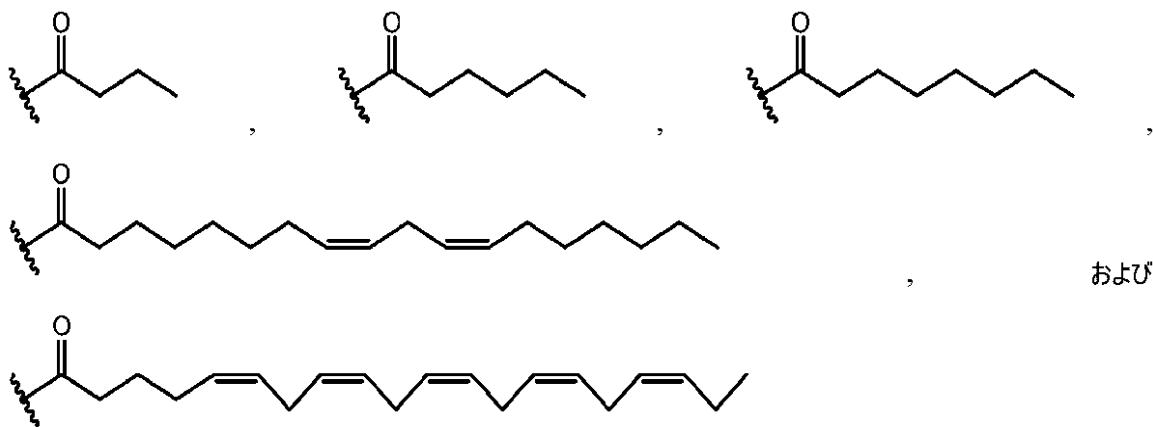
(項目37)

$R^{4a}$ および $R^{4b}$ が独立して、 $-C(O)R'$ である、項目32から35のいずれかに記載の化合物。

(項目38)

$R^{4a}$ および $R^{4b}$ が、

## 【化94】



からなる群より独立して選択される、項目37に記載の化合物。

(項目39)

$R^{4a}$ および $R^{4b}$ が独立して、 $-C(O)-Y-C(O)OR'$ である、項目32から35のいずれかに記載の化合物。

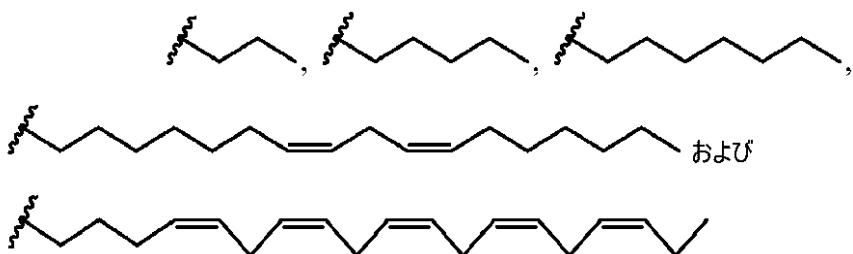
(項目40)

$R'$ が水素である、項目39に記載の化合物。

(項目41)

$R'$ 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 40 に記載の化合物。

---

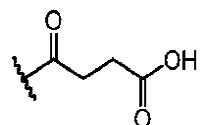
(項目42)

Yがそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>炭化水素鎖である、項目39から41のいずれかに記載の化合物。

（項目43）

R<sup>4</sup> a および R<sup>4</sup> b が、

【化 9 6 】

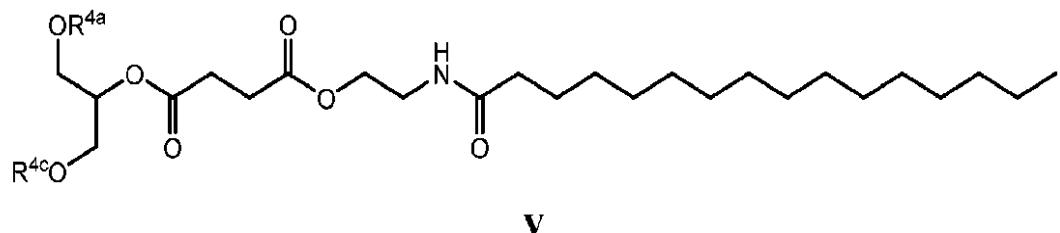


である、項目 39 に記載の化合物。

（項目44）

或  $V_i$

【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<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub> 脂肪族からなる群により独立して選択され、

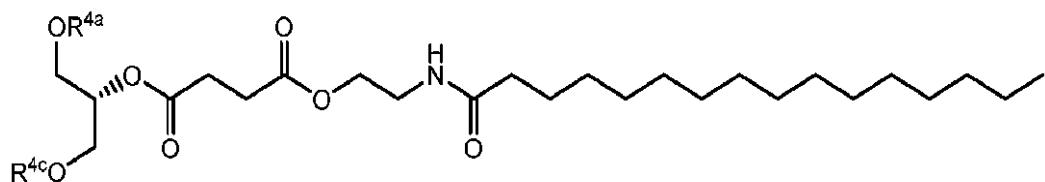
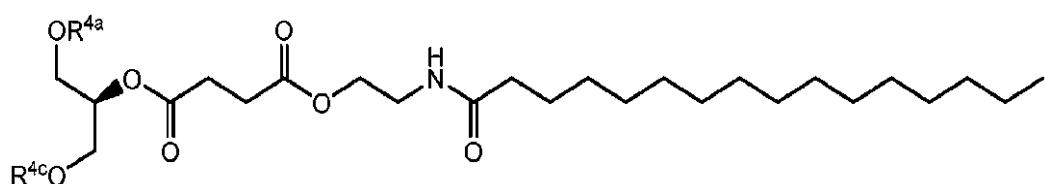
Yはそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub>~<sub>20</sub>炭化水素鎖である、項目5に記載の化合物。

---

( 項 目 4 5 )

式  $V'$  または  $V''$  :

【化 9 8】



である、項目44に記載の化合物。

(項目46)

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47)

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46に記載の化合物。

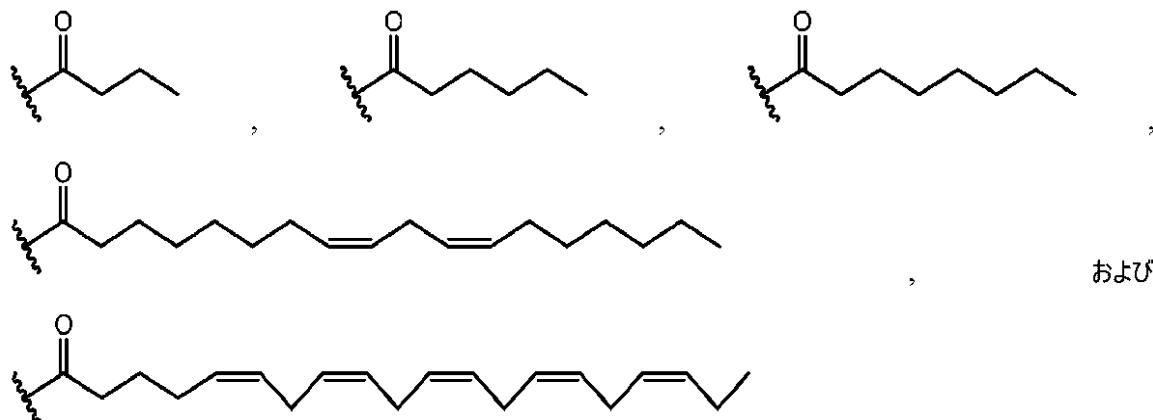
(項目48)

R<sup>4</sup>-a および R<sup>4</sup>-c 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 )

項目 1-2) R<sup>4</sup> a および R<sup>4</sup> c が、

【化 9 9】



からなる群より独立して選択される、項目 44 から 47 のいずれかに記載の化合物。

( 項目 50 )

R<sup>4a</sup> および R<sup>4c</sup> が独立して、 -C(=O)-Y-C(=O)OR' である、項目 44 から 47 のいずれかに記載の化合物。

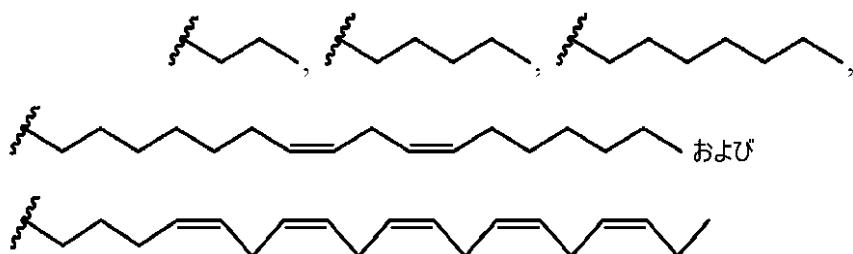
### (項目51)

R' が水素である、項目 50 に記載の化合物。

( 項目 5.2 )

R' がそれぞれ

【化100】



からなる群より独立して選択される、項目50に記載の化合物。

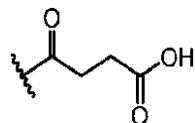
(項目53)

Yがそれぞれ、独立して、二価の直鎖または分岐状C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>炭化水素鎖である、項目50から52のいずれかに記載の化合物。

(項目54)

R<sup>4-a</sup>およびR<sup>4-c</sup>が、

【化101】

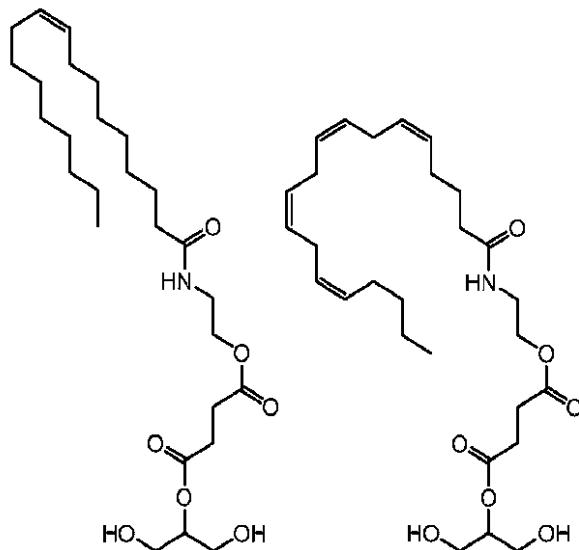


である、項目53に記載の化合物。

(項目55)

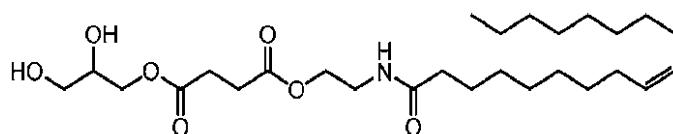
以下：

【化102-1】

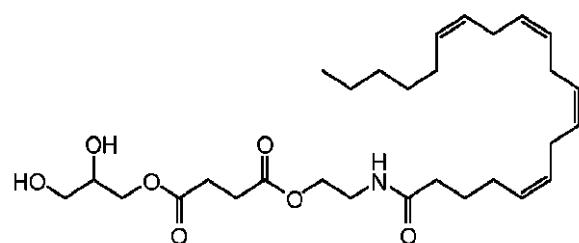
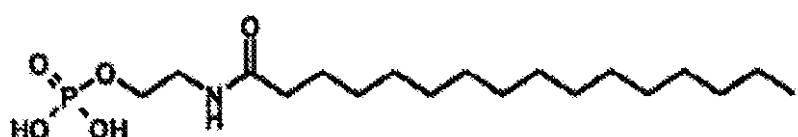
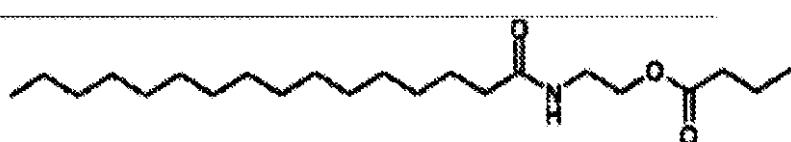
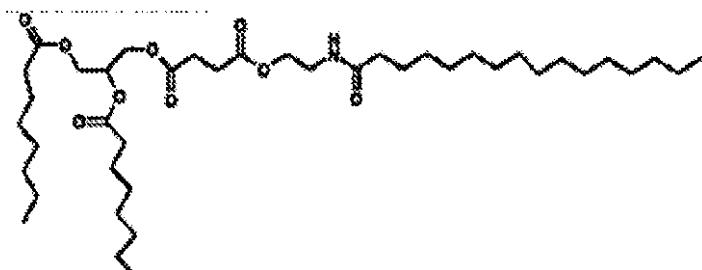
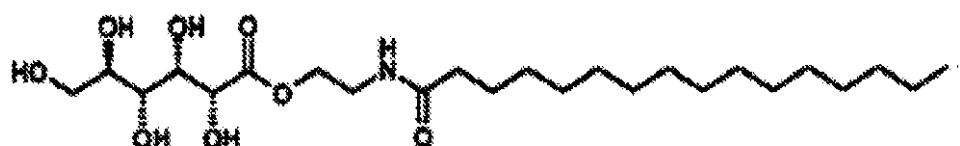
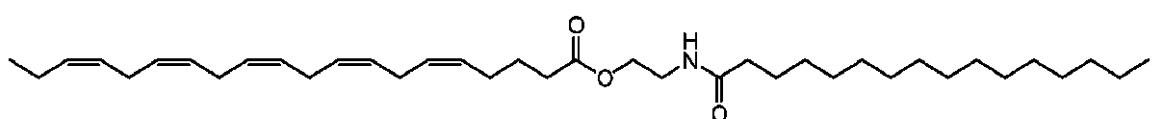


I-a-2

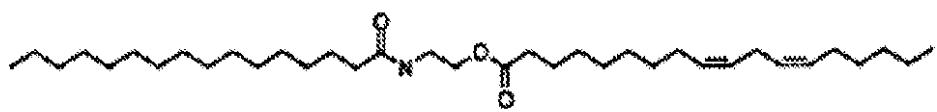
I-a-3



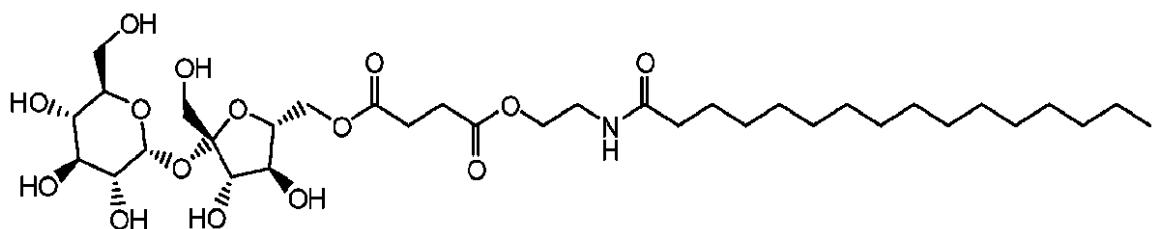
【化 1 0 2 - 2】

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

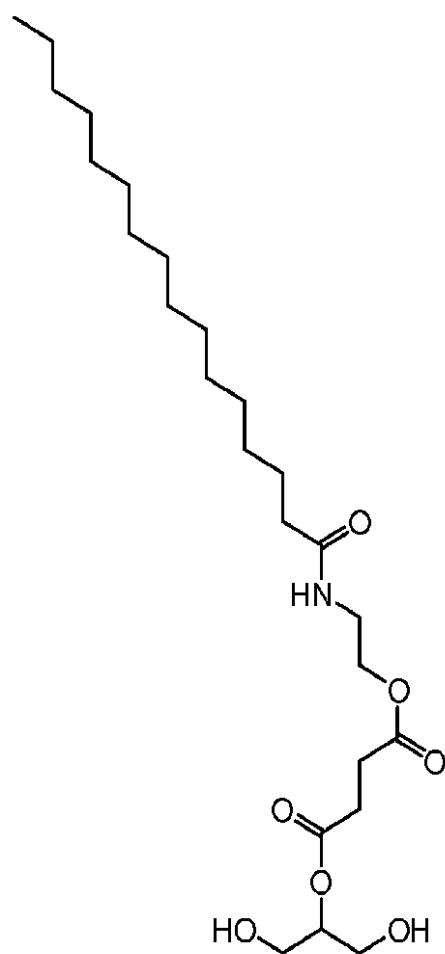
【化 1 0 2 - 3 】



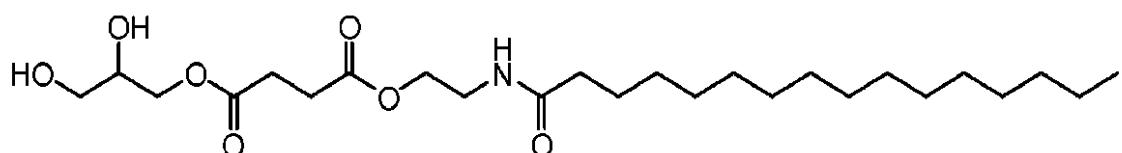
I-6



I-7



I-8 or



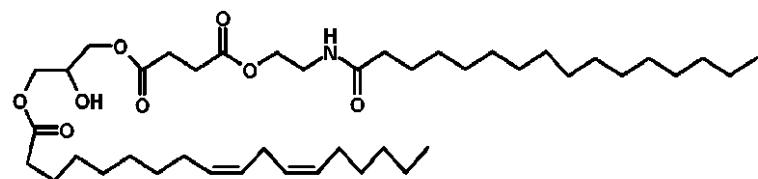
I-9

から選択される化合物。

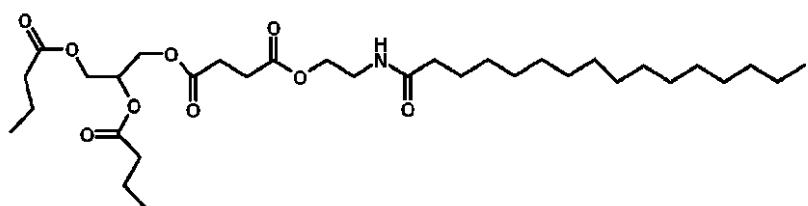
(項目 5 6 )

以下 :

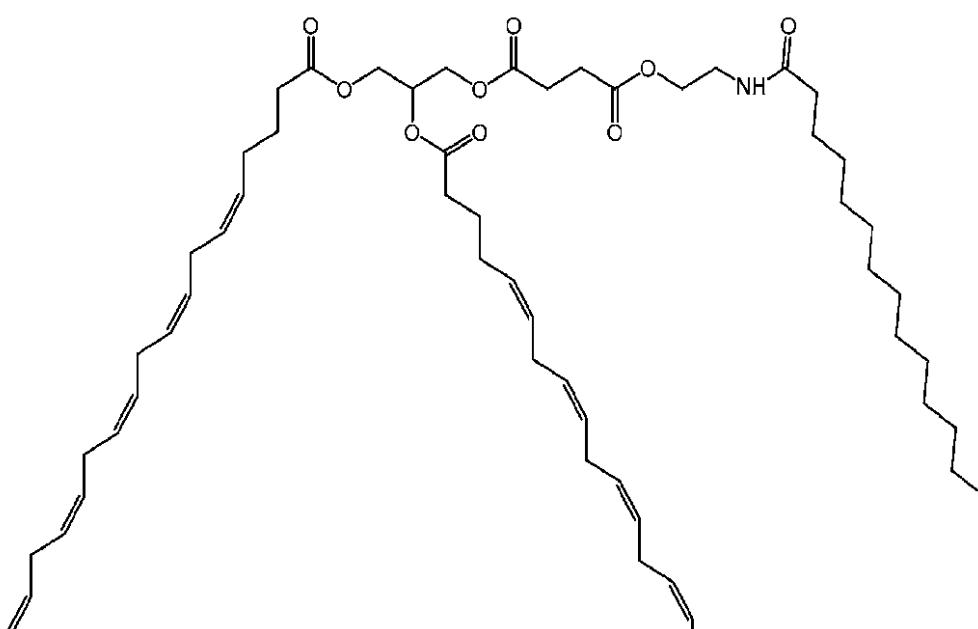
【化 1 0 3 - 1】



I-10

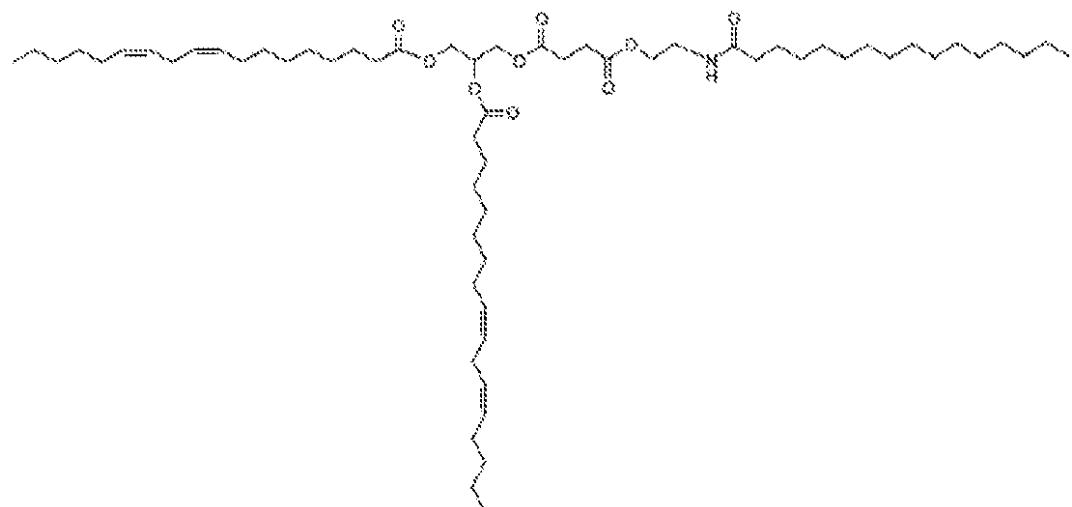


I-11

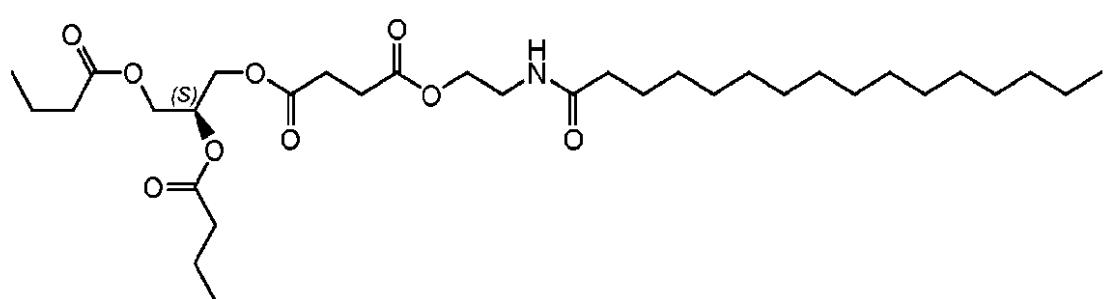


I-12

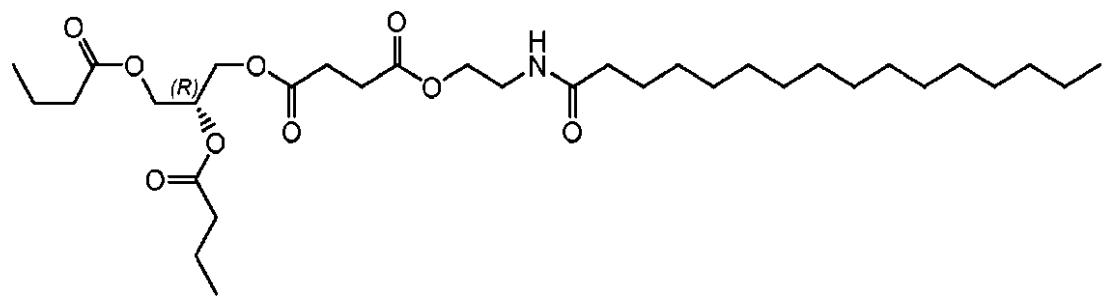
【化 1 0 3 - 2】



I-13

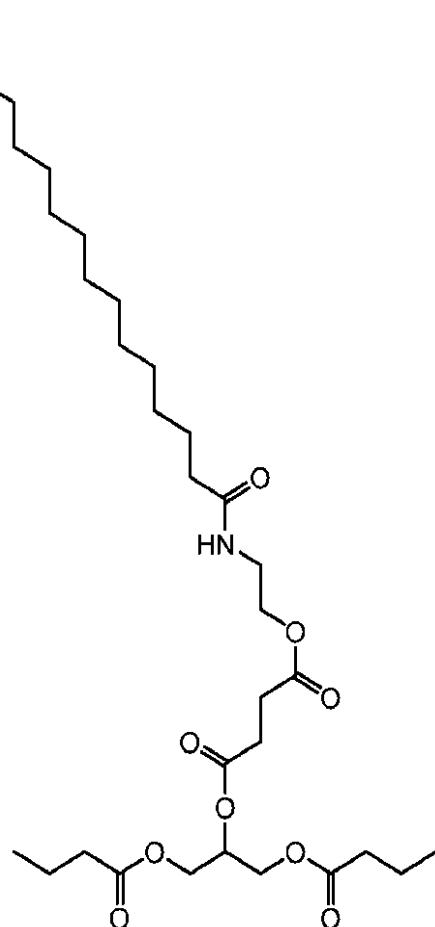


I-14



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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> または R<sup>3</sup> 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、14 から 24、および 29 から 31 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、異なる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、固体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 )

前記固体製剤が錠剤である、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 )

前記固体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84)

前記医薬組成物が、液体であるか、または液体を含む、項目74から78のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目85)

前記医薬組成物が、ゲルであるか、またはゲルを含む、項目74から78のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目86)

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74から78のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目87)

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74から78のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目88)

前記医薬組成物が、粉末であるか、または粉末を含む、項目74から78のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目89)

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74に記載の医薬組成物。

(項目90)

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74から78、または89のいずれかに記載の医薬製剤。

(項目91)

前記医薬組成物が、軟膏剤として製剤化されている、項目74から78、または89のいずれかに記載の医薬製剤。

(項目92)

前記医薬組成物が、泡沢として製剤化されている、項目74から78、または89のいずれかに記載の医薬製剤。

(項目93)

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73に記載の化合物、または項目74から92のいずれかに記載の医薬組成物。

(項目94)

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73のいずれかに記載の構造の化合物、または項目74から92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95)

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させて投与される、項目94に記載の方法。

(項目96)

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94または95に記載の方法。

(項目97)

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94または95に記載の方法。

(項目98)

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94または95に記載の方法。

(項目99)

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94または95に記載の方法。

(項目100)

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94または95に記載の方法。

(項目101)

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94または95に記載の方法。

(項目102)

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94または95に記載の方法。

(項目103)

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94または95に記載の方法。

(項目104)

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94または95に記載の方法。

(項目105)

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94または95に記載の方法。

(項目106)

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94または95に記載の方法。

(項目107)

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94または95に記載の方法。

(項目108)

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94または95に記載の方法。

(項目109)

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94または95に記載の方法。

(項目110)

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94または95に記載の方法。

(項目111)

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94または95に記載の方法。

(項目112)

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94または95に記載の方法。

(項目113)

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94または95に記載の方法。

(項目114)

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94または95に記載の方法。

(項目115)

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94または95に記載の方法。

(項目116)

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94または95に記載の方法。

(項目117)

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94または95に記載の方法。

(項目118)

前記疾患、障害または状態が、縁内障であるかまたはそれを含む、項目94または95に記載の方法。

(項目119)

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94または95に記載の方法。

(項目120)

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94または95に記載の方法。

(項目121)

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94または95に記載の方法。

(項目122)

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94または95に記載の方法。

(項目123)

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94または95に記載の方法。

(項目124)

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94または95に記載の方法。

(項目125)

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73のいずれかに記載の構造の化合物、または項目74から92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126)

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73のいずれかに記載の構造の化合物、または項目74から92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127)

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73のいずれかに記載の構造の化合物、または項目74から92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128)

医薬組成物を製造する方法であって、

項目1から73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129)

N-アシリ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<sub>2</sub>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130)

項目1から73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<sub>2</sub>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131)

項目1から73のいずれかに記載の化合物を製造する方法であって、X<sub>2</sub>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<sub>2</sub>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。