

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2002-507209(P2002-507209A)

【公表日】平成14年3月5日(2002.3.5)

【出願番号】特願平11-505398

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/20
A 6 1 K 31/16
A 6 1 K 31/201
A 6 1 K 31/202
A 6 1 K 31/23
A 6 1 K 31/231
A 6 1 K 31/232
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 7/02
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 43/00

【F I】

A 6 1 K 31/20
A 6 1 K 31/16
A 6 1 K 31/201
A 6 1 K 31/202
A 6 1 K 31/23
A 6 1 K 31/231
A 6 1 K 31/232
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 7/02
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 29/00 1 0 1
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17年6月16日(2005.6.16)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり
【補正方法】変更
【補正の内容】

手続補正書

平成17年 6月16日

特許庁長官殿



1. 事件の表示

平成11年特許願第505398号

2. 補正をする者

氏名(名称) シンドロメクス・リミテッド

3. 代理人

住所

〒540-0001
大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル
青山特許事務所
電話 06-6949-1261 FAX 06-6949-0361

氏名

弁理士 (6214) 青山 葆



4. 補正対象書類名 請求の範囲

5. 補正対象項目名 請求の範囲

6. 補正の内容
別紙の通り。



(別紙)

請 求 の 範 囲

1. 医療上有効量の式 $R-COOH$ の化合物、但し、式中 R は、炭素原子10－24の飽和または不飽和のアルキル鎖を意味し、該炭素原子の一つまたはそれ以上がヘテロ原子で置換されていてもよく、所望により該炭素またはヘテロ原子鎖メンバーの一つまたはそれ以上が環の一部を構成しており、所望により該鎖はヒドロカルビル基、ヘテロシクリル基、低級アルコキシ、ヒドロキシル置換低級アルキル、ヒドロキシル、カルボキシル、ハロゲン、フェニルまたは（ヒドロキシー、低級アルキルー、低級アルコキシー、低級アルケニルーまたは低級アルキニル）－置換フェニル、 C_3-C_7 シクロアルキルまたは（ヒドロキシー、低級アルキルー、低級アルコキシー、低級アルケニルーまたは低級アルキニル）－置換 C_3-C_7 シクロアルキルで置換されており、該化合物は、それぞれの補酵素Aチオエステル、 $RCOSCoA$ 、に生体内で転換され得るものである、または、該化合物の塩、エステルまたはアミドを含んでなる、医薬組成物。
2. R が、 ω －カルボキシル、 ω －ヒドロキシルボロン、および ω －ヒドロキシル鎖からなる群から選ばれるものである、請求項1に記載の組成物。
3. $RCOOH$ が、クロフィブリン酸またはフィブリン酸、またはそれらの塩、エステル、アミド、または誘導体のいずれかである、請求項1に記載の組成物。
4. $RCOOH$ が、非ステロイド性抗炎症薬（NSAID）である、請求項1に記載の組成物。
5. $RCOOH$ が、長鎖脂肪酸である、請求項1に記載の組成物。
6. 脂肪酸が、
 - ステアリン（18：0）酸
 - オレイン（18：1）酸
 - リノレン（18：2）酸
 - リノレン（18：3）酸
 - エイコサペンタエン（20：5）酸
 - ドコサヘキサエン（22：6）酸

から選ばれるものである、請求項5に記載の組成物。

7. 有効性化合物が下記化合物、但し、式中Rが ω -カルボキシルであり、そして、RCOOHが、

- 1, 16-ヘキサデカンジオイック酸、
- 1, 18-オクタデカンジオイック酸、
- 2, 2, 15, 15-テトラメチル-ヘキサデカン-1, 16-ジオイック酸、
- 2, 2, 17, 17-テトラメチル-オクタデカン-1, 18-ジオイック酸、
- 3, 3, 14, 14-テトラメチル-ヘキサデカン-1, 16-ジオイック酸、
- 3, 3, 16, 16-テトラメチル-オクタデカン-1, 18-ジオイック酸、
- 4, 4, 13, 13-テトラメチル-ヘキサデカン-1, 16-ジオイック酸、
- および

- 4, 4, 15, 15-テトラメチル-オクタデカン-1, 18-ジオイック酸、

からなる群から選ばれるものである、請求項1に記載の組成物。

8. Rが ω -ヒドロキシボロンであり、そして、RCOOHが、

- 16-B(OH)₂-ヘキサデカン酸、
- 18-B(OH)₂-オクタデカン酸、
- 16-B(OH)₂-2, 2-ジメチル-ヘキサデカン酸、
- 18-B(OH)₂-2, 2-ジメチル-オクタデカン酸、
- 16-B(OH)₂-3, 3-ジメチル-ヘキサデカン酸、
- 18-B(OH)₂-3, 3-ジメチル-オクタデカン酸、
- 16-B(OH)₂-4, 4-ジメチル-ヘキサデカン酸、
- 18-B(OH)₂-4, 4-ジメチル-オクタデカン酸、

からなる群から選ばれるものである、請求項1に記載の組成物。

9. Rが ω -ヒドロキシであり、そして、RCOOHが、

- 16-ヒドロキシ-ヘキサデカン酸、
- 18-ヒドロキシ-オクタデカン酸、
- 16-ヒドロキシ-2, 2-ジメチル-ヘキサデカン酸、
- 18-ヒドロキシ-2, 2-ジメチル-オクタデカン酸、
- 16-ヒドロキシ-3, 3-ジメチル-ヘキサデカン酸、

18-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-オクタデカン酸、

16-ヒドロキシ-4,4-ジメチル-ヘキサデカン酸、

18-ヒドロキシ-4,4-ジメチル-オクタデカン酸、

からなる群から選ばれるものである、請求項1に記載の組成物。

10. 異リポ蛋白血症（高コレステロール血症、高トリグリセリド血症、低HDL-コレステロール症）処置用の、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

11. インシュリン抵抗性、グルコース耐性不全症、およびNIDDM処置用の、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

12. 本態性高血圧症処置用の、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

13. 血液凝固能低下用、または血液線維素溶解増加用の、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

14. 代謝性症状（症状-X）の処置用、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

15. アテローム性冠状または末梢動脈硬化症の処置用、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

16. リューマチ様関節炎、多発性硬化症、乾癬または炎症性腸疾患の処置用、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

17. 胸部癌、結腸癌、または、前立腺癌の処置用、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

18. 局所使用用、請求項1ないし9のいずれかに記載の組成物。

19. HNF-4制御転写を阻害する化合物を医療上有効量投与することを含んで成る、症状-X処置方法。

20. 該化合物が、それぞれのC o Aチオエステルに転換され得る両親媒性カルボキシレートである、請求項19に記載の方法。

21. 該両親媒性カルボキシレートが、異種生物性両親媒性カルボキシレートである、請求項20に記載の方法。

22. 該化合物が、二量体-オリゴマー平衡をオリゴマーに有利な方向にシフトさせるものである、請求項19に記載の方法。

23. 該化合物が、標的遺伝子に対するHNF-4二量体の結合親和性を減少さ

せるものである、請求項19または28に記載の方法。

24. 長鎖脂肪酸を医療上有効量投与することを含むものである、請求項19に記載の方法。

25. 該両親媒性カルボキシレートが、不飽和脂肪酸である、請求項20に記載の方法。

26. 該両親媒性カルボキシレートが、ポリ不飽和脂肪酸である、請求項20に記載の方法。

27. 該両親媒性カルボキシレートが、炭素原子約12-24の脂肪酸である、請求項20に記載の方法。

28. 両親媒性カルボキシレートを医療上有効量投与することを含んでなる、HNF-4 α 転写活性の調節方法。

29. 該調節が、HNF-4活性の阻害である、請求項28に記載の方法。

30. 該調節が、HNF-4活性の活性化である、請求項28に記載の方法。

31. 該両親媒性カルボキシレートが、C18:3脂肪酸である、請求項20または28に記載の方法。

32. 該両親媒性カルボキシレートが、C20:5脂肪酸である、請求項20または28に記載の方法。

33. 該両親媒性カルボキシレートが、それぞれのCoAチオエステルに転換され得る脂肪酸である、請求項20または28に記載の方法。

34. アテローム性冠状または末梢動脈硬化症処置のための、請求項28に記載の方法。

35. リューマチ様関節炎、多発性硬化症、乾癬または炎症性腸疾患の処置のための、請求項28に記載の方法。

36. 胸部癌、結腸癌、または、前立腺癌の処置のための、請求項28に記載の方法。