

【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3年8月5日(2021.8.5)

【公表番号】特表2020-525548(P2020-525548A)

【公表日】令和2年8月27日(2020.8.27)

【年通号数】公開・登録公報2020-034

【出願番号】特願2020-522278(P2020-522278)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 29/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 29/02

A 6 1 P 25/04

【手続補正書】

【提出日】令和3年6月22日(2021.6.22)

【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

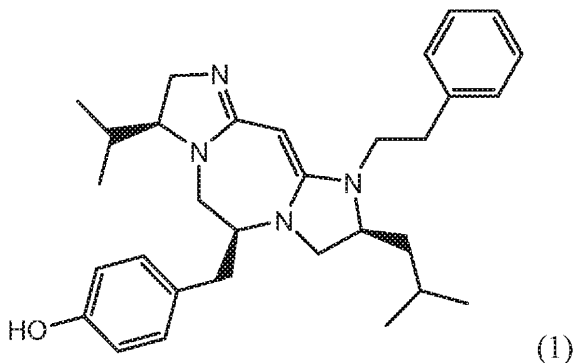
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

対象において、炎症によって引き起こされる疼痛を処置するための薬学的組成物であって、治療的有效量の化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体を含む、薬学的組成物。

【請求項2】

前記疼痛が、炎症反応の開始によって引き起こされる、請求項1記載の薬学的組成物。

【請求項3】

前記疼痛が痛覚過敏と関連する、請求項1または2記載の薬学的組成物。

【請求項4】

前記疼痛が慢性疼痛または亜急性疼痛である、請求項1～3のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項5】

前記慢性疼痛が、関節炎痛、腰痛、神経障害性疼痛、内臓痛、癌が原因の疼痛、損傷が原因の疼痛、関節の炎症が原因の疼痛、背部障害が原因の疼痛、または頸部痛である、請

求項1～4のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項6】

癌が原因の前記疼痛が、腹腔内、腹部、および骨盤内器官に関与する癌、または骨癌もしくは骨転移によって引き起こされる、請求項5記載の薬学的組成物。

【請求項7】

損傷が原因の前記疼痛が、骨、靱帯、または腱の損傷によって引き起こされる、請求項5記載の薬学的組成物。

【請求項8】

化合物1が中枢神経系作用性オピオイドと同程度まで疼痛を低減させる、請求項1～7のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項9】

前記中枢神経系作用性オピオイドが μ 受容体を活性化する、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項10】

前記中枢神経系作用性オピオイドがモルヒネである、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項11】

化合物1の投与がいかなる中枢神経系副作用ももたらさない、請求項1～10のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項12】

前記中枢神経系副作用が、嗜癖、便秘、鎮静、精神機能障害、傾眠、呼吸抑制、悪心、不快気分、または発作である、請求項11記載の薬学的組成物。

【請求項13】

化合物1の投与が便秘をもたらさない、請求項12記載の薬学的組成物。

【請求項14】

化合物1の投与が嗜癖をもたらさない、請求項12記載の薬学的組成物。

【請求項15】

化合物1が、オピオイド受容体とオピオイド受容体との相乗的活性化をもたらし、請求項1～14のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項16】

相乗作用が、受容体活性による受容体のアロステリック調節に起因する、請求項15記載の薬学的組成物。

【請求項17】

化合物1の投与が、急性疼痛の処置について、受容体アゴニストと同様であるか、またはそれより優れている、請求項1～16のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項18】

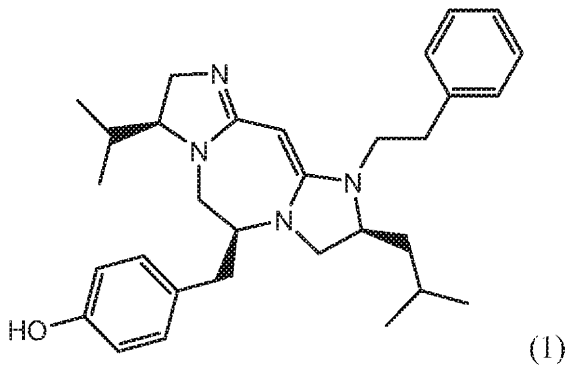
化合物1の投与が、痛覚過敏の処置について、受容体アゴニストと同様であるか、またはそれより優れている、請求項1～17のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項19】

化合物1の投与が、受容体アゴニストと比較して、低減した尿量をもたらし、請求項1～18のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項20】

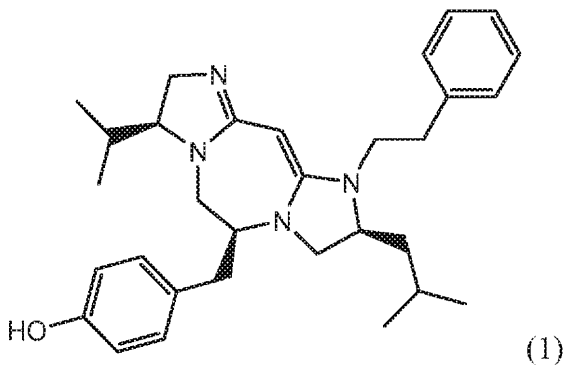
炎症によってまたは炎症反応の開始によって引き起こされる疼痛の処置のための医薬の製造における、化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体の使用。

【請求項 2 1】

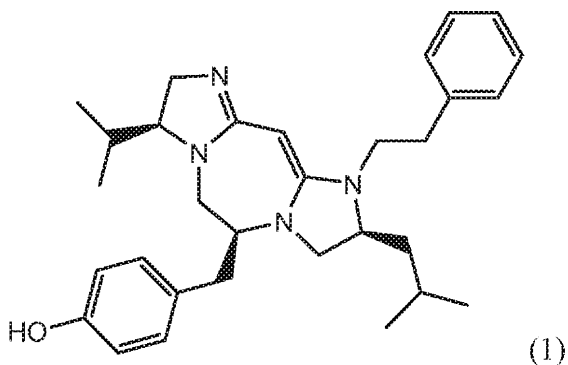
炎症によってまたは炎症反応の開始によって引き起こされる疼痛の予防のための医薬の製造における、化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体の使用。

【請求項 2 2】

化合物1



および薬学的に許容される担体を含む、薬学的組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

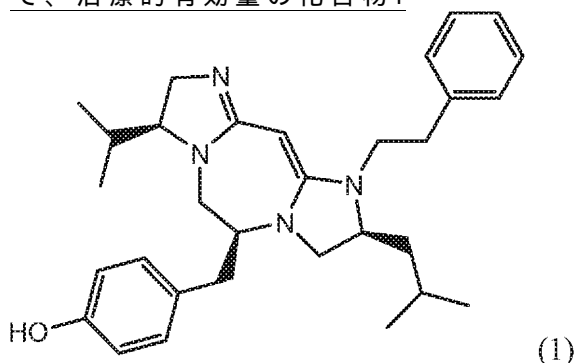
【0023】

1つまたは複数の態様では、化合物1は オピオイド受容体と オピオイド受容体との相乗的活性化をもたらす。1つまたは複数の態様では、相乗作用は、作用を増強する作用に起因する。1つまたは複数の態様では、化合物1の投与は、疼痛（例えば、炎症性疼痛）の処置について、受容体アゴニストと同様であるか、またはそれより優れている。1

つまたは複数の態様では、化合物1の投与は、痛覚過敏の処置について、受容体アゴニストと同様であるか、またはそれより優れている。1つまたは複数の態様では、化合物1の投与は受容体アゴニストと比較して、低減した尿量をもたらす。

[本発明1001]

その必要がある対象において、炎症によって引き起こされる疼痛を処置する方法であって、治療的有効量の化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体を該対象に投与することを含む、方法。

[本発明1002]

前記疼痛が、炎症反応の開始によって引き起こされる、本発明1001の方法。

[本発明1003]

前記疼痛が痛覚過敏と関連する、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1004]

前記疼痛が慢性疼痛または亜急性疼痛である、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1005]

前記慢性疼痛が、関節炎痛、腰痛、神経障害性疼痛、内臓痛、癌が原因の疼痛、損傷が原因の疼痛、関節の炎症が原因の疼痛、背部障害が原因の疼痛、または頸部痛である、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1006]

癌が原因の前記疼痛が、腹腔内、腹部、および骨盤内器官に關与する癌、または骨癌もしくは骨転移によって引き起こされる、本発明1005の方法。

[本発明1007]

損傷が原因の前記疼痛が、骨、靱帯、または腱の損傷によって引き起こされる、本発明1005の方法。

[本発明1008]

化合物1が中枢神経系作用性オピオイドと同程度まで疼痛を低減させる、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1009]

前記中枢神経系作用性オピオイドが μ 受容体を活性化する、本発明1008の方法。

[本発明1010]

前記中枢神経系作用性オピオイドがモルヒネである、本発明1008の方法。

[本発明1011]

化合物1の投与がいかなる中枢神経系副作用ももたらさない、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1012]

前記中枢神経系副作用が、嗜癖、便秘、鎮静、精神機能障害、傾眠、呼吸抑制、悪心、不快気分、または発作である、本発明1011の方法。

[本発明1013]

化合物1の投与が便秘をもたらさない、本発明1012の方法。

[本発明1014]

化合物1の投与が嗜癮をもたらさない、本発明1012の方法。

[本発明1015]

化合物1が、オピオイド受容体とオピオイド受容体との相乗的活性化をもたらす、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1016]

相乗作用が、受容体活性による受容体のアロステリック調節に起因する、本発明1016の方法。

[本発明1017]

化合物1の投与が、急性疼痛の処置について、受容体アゴニストと同様であるか、またはそれより優れている、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1018]

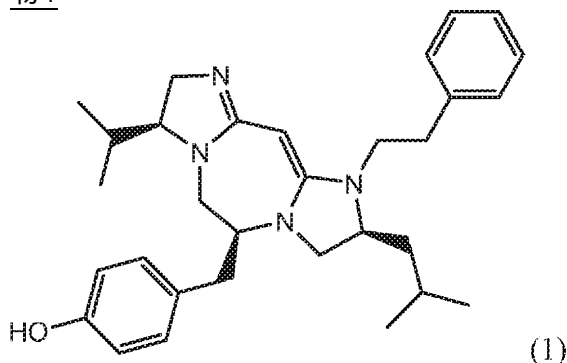
化合物1の投与が、痛覚過敏の処置について、受容体アゴニストと同様であるか、またはそれより優れている、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1019]

化合物1の投与が、受容体アゴニストと比較して、低減した尿量をもたらす、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1020]

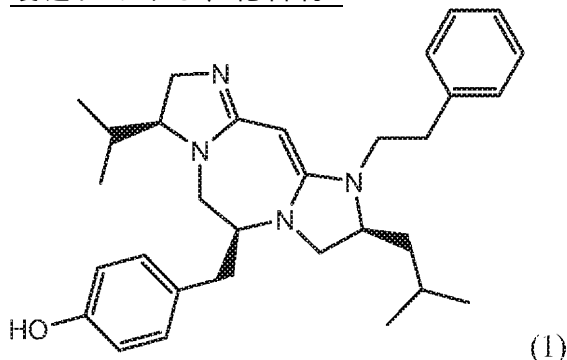
炎症によってまたは炎症反応の開始によって引き起こされる疼痛の処置のための、化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体の使用。

[本発明1021]

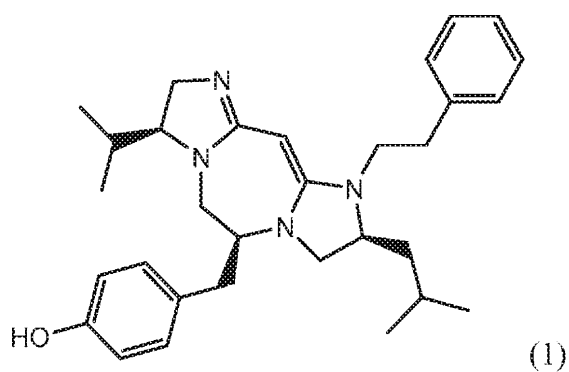
炎症によってまたは炎症反応の開始によって引き起こされる疼痛の処置のための医薬の製造における、化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体の使用。

[本発明1022]

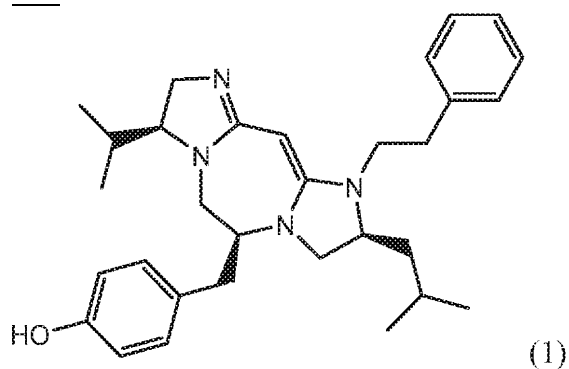
その必要がある対象において、炎症によってまたは炎症反応の開始によって引き起こされる疼痛を予防する方法であって、治療的有効量の化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体を該対象に投与することを含む、方法。

[本発明1023]

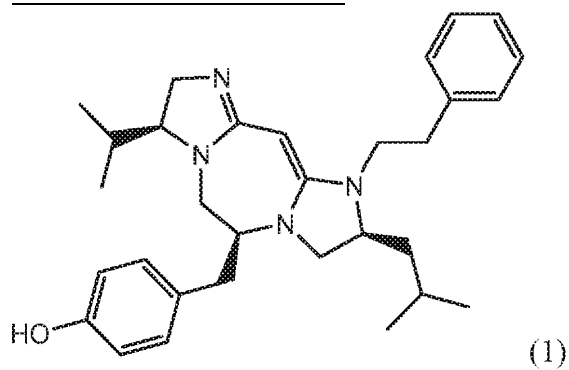
炎症によってまたは炎症反応の開始によって引き起こされる疼痛の予防のための、化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体の使用。

[本発明1024]

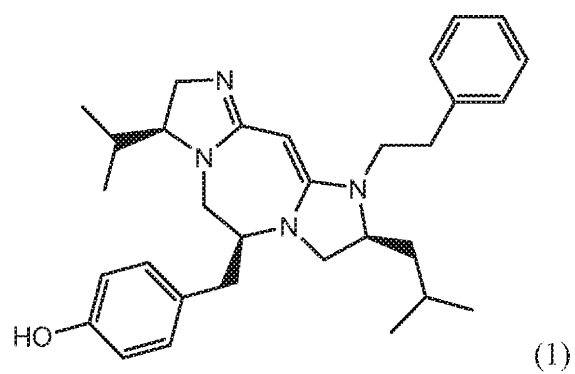
炎症によってまたは炎症反応の開始によって引き起こされる疼痛の予防のための医薬の製造における、化合物1



またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和化合物、水和物、互変異性体、もしくは異性体の使用。

[本発明1025]

化合物1



および薬学的に許容される担体を含む、薬学的組成物。