

【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20年8月14日(2008.8.14)

【公表番号】特表2004-505898(P2004-505898A)

【公表日】平成16年2月26日(2004.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2004-008

【出願番号】特願2002-517004(P2002-517004)

【国際特許分類】

C 0 7 F 9/09 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 K 47/06 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 31/10 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 K 38/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 9/09 Z
C 0 7 F 9/09 K
C 0 7 F 9/09 V
A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 47/06
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 35/02
A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年6月23日(2008.6.23)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

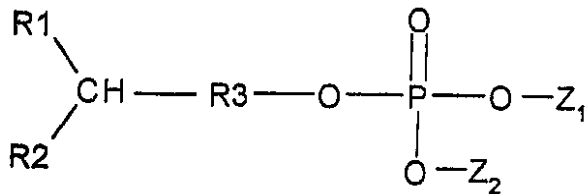
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式I

(I)



(上記式中、

R 1 及び R 2 は 2 - 30 個の炭素原子を含んでなる同一であるか又は異なっている飽和又は不飽和脂肪族鎖であり、

R 3 は A - [CH₂]_m - B - [CH₂]_n - C - [CH₂]_p - D であり、m、n 及び p はそれぞれ独立して 0 又は 1 - 12 の整数であり、A、B、C 及び D はそれぞれ共有結合、アミノ、アミド、酸素、チオ、カルボニル、カルボキシル、オキシカルボニル、チオカルボニル、ホスファート、アミノホスファートモノ -、ジ - 及びトリ - アミノホスファート基から独立して選択され、但し、2 個の酸素原子は互いに直接結合せず、ここにおいて - R 3 - O - はモノ - エチレングリコール又はジ - エチレングリコール残基を含み、

Z₁ 及び Z₂ は同一であるか又は異なっており、それぞれ存在しないか、あるいは a) 水素、ナトリウム、リチウム、カリウム、アンモニウム、モノ -、ジ -、トリ - 及びテトラ - アルキルアンモニウムから独立して選択されるか、又は b) ホスホ基と一緒にグリセロール、コリン、エタノールアミン、イノシトール、セリン、モノ - 又はオリゴ糖のホスホエステルを形成する) の化合物、又はその薬学上許容可能な塩。

【請求項 2】 R 1 の長さが 3 炭素原子であり、R 2 の長さが 12 - 16 炭素原子である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】 R 1 がプロピルであり、R 2 がドデシルである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】 R 2 及び R 3 を一緒にした炭素原子の総数が 6 - 26 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】 R 2 及び R 3 を一緒にした炭素原子の総数が 16 - 22 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】 Z₁ がコリンである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】 Z₁ がナトリウムであり、Z₂ が水素及びナトリウムから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】 4 - ヘキサデカノイルオキシエチルホスファート (3, 12 - MEG - PO₄)、

2 - (4' - ヘキサデカノイルオキシ)エトキシエチルホスファート (3, 12 - DEG - PO₄)、

4 - ヘキサデカニルオキシエチルホスファート (3, 12 - (エーテル) - MEG - PO₄)、

2 - (4' - ヘキサデカニルオキシ)エトキシエチルホスファート (3, 12 - (エーテル) - DEG - PO₄)、

2 - (4 - ヘキサデカノイルオキシ)エチルホスホコリン (3, 12 - MEG - PC)

、

2 - (4 - ヘキサデカノイルオキシ)エトキシエチルホスホコリン (3, 12 - DEG - PC)、

2 - { 2' - [10" - (ヘキサデシル - 4 - オキシ)デシル - 1 - オキシ] エトキシ } エチルホスファート (3, 12 - O - C₁₀ - DEG - PO₄)、

2 - { 2' - [10" - (ヘキサデシル - 4 - オキシ)デシル - 1 - オキシ] エトキシ } エチルホスホコリン (3, 12 - O - C₁₀ - DEG - PC)、

- 4 - オクタデカノイルオキシエチルホスファート (3, 14 - MEG - PO₄)、
 2 - (4' - オクタデカノイルオキシ) エトキシエチルホスファート (3, 14 - DEG - PO₄)、
 4 - オクタデカニルオキシエチルホスファート (3, 14 - (エーテル) - MEG - PO₄)、
 2 - (4' - オクタデカニルオキシ) エトキシエチルホスファート (3, 14 - (エーテル) - DEG - PO₄)、
2 - (4 - オクタデカノイルオキシ) エチルホスホコリン (3, 14 - MEG - PC)、
 2 - (4 - オクタデカノイルオキシ) エトキシエチルホスホコリン (3, 14 - DEG - PC)、
 4 - エイコサノイルオキシエチルホスファート (3, 16 - MEG - PO₄)、
 2 - (4' - エイコサノイルオキシ) エトキシエチルホスファート (3, 16 - DEG - PO₄)、
 4 - エイコサニルオキシエチルホスファート (3, 16 - (エーテル) - MEG - PO₄)、
 2 - (4' - エイコサニルオキシ) エトキシエチルホスファート (3, 16 - (エーテル) - DEG - PO₄)、
2 - (4 - エイコサノイルオキシ) エチルホスホコリン (3, 16 - MEG - PC)、
 2 - (4 - エイコサノイルオキシ) エトキシエチルホスホコリン (3, 16 - DEG - PC)、
2 - [2' - (2" - プロピルエイコサノイルオキシ) - エトキシ] エチルホスファート (3, 18 - DEG - PO₄)、及び
 2 - (2' - プロピルエイコサノイルオキシ) エトキシエチルホスホコリン (3, 18 - DEG - PC)

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

- 【請求項 9】 2 - (4' - ヘキサデカノイルオキシ) エトキシエチルホスファート
 ナトリウム塩、
2 - (4' - ヘキサデカノイルオキシ) エトキシエチルホスファートナトリウム塩、
2 - (4' - ヘキサデカニルオキシ) エトキシエチルホスファート、
2 - (4 - ヘキサデカノイルオキシ) エチルホスホコリン、及び
2 - (4 - ヘキサデカノイルオキシ) エトキシエチルホスホコリン

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】 薬学上許容可能なキャリアと請求項 1 - 9 のいずれか一項に記載の化合物を含んでなる医薬組成物。

【請求項 11】 生物学的活性剤をさらに含んでなる、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】 生物学的活性剤が治療薬、抗癌剤又は診断薬である、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】 請求項 1 - 9 のいずれか一項に記載の一般式 I の化合物を含む、生物学的バリアーの透過性を増加させるための薬物。

【請求項 14】 生物学的バリアーが皮膚、角膜、結膜、鼻、気管支、頬、膈及び消化器上皮、血液網膜関門、血液脳関門、血液精巣関門、血液腫瘍関門、及び血液腎間相 (blood kidney interphase) からなる群から選択される、請求項 13 に記載の薬物。

【請求項 15】 特定の部位又は器官における生物学的活性剤の透過及び/又は蓄積を可能とし又は増加させるための医薬組成物であって、上記生物学的活性剤と請求項 10 に記載の医薬組成物の有効量とを含む、上記医薬組成物。

【請求項 16】 上記の特定部位又は器官が脊髄、脳、眼、精巣、腺又は腫瘍である、請求項 15 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】 他の治療薬と組み合わせる、中枢神経系の疾患又は障害の治療のための請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】 上記他の治療薬が抗腫瘍、抗ウイルス、抗微生物、抗真菌、抗炎症、神経保護薬、及び生物活性ペプチド及びタンパク質からなる群から選択される、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】 腫瘍の治療のための、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】 抗癌剤の有効量をさらに含むか、又は、抗癌剤の有効量とともに投与される請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】 腫瘍が、中枢神経系にある腫瘍、脳にある腫瘍であるか又は、癌、神経膠腫、神経芽細胞腫、網膜芽細胞腫、リンパ腫、白血病、肉腫、及び黒色腫からなる群から選択される、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】 上記腫瘍が原発性又は二次的腫瘍である、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】 眼科疾患又は障害の治療用の請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】 追加的生物学的活性剤の有効量を含むか、又は共に処方される、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】 眼科疾患又は障害が類囊胞斑状水腫 (CME)、加齢性斑状変性 (ARMD)、眼内感染症、眼内炎症、及び眼内悪性腫瘍から選択される、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】 経口投与用、動脈内投与用、髄腔内投与用、非経口投与用、局所投与用、局所灌流用、浣腸用、又は器官内洗浄用の、請求項 15 - 25 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 27】 生物学的バリアーによって保護された器官中への診断薬の蓄積を増加させるための、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 28】 上記の生物学的バリアーによって保護された器官が中枢神経系である、請求項 27 に記載の医薬組成物。