

【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24年12月20日 (2012.12.20)

【公表番号】特表2012-507577(P2012-507577A)

【公表日】平成24年3月29日 (2012.3.29)

【年通号数】公開・登録公報2012-013

【出願番号】特願2011-535207(P2011-535207)

【国際特許分類】

C 07 F	9/10	(2006.01)
A 61 K	31/685	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	37/08	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	1/16	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	15/00	(2006.01)
A 61 P	19/04	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)

【F I】

C 07 F	9/10	C S P B
A 61 K	31/685	
A 61 P	29/00	
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	37/06	
A 61 P	31/04	
A 61 P	35/00	
A 61 P	37/08	
A 61 P	9/00	
A 61 P	1/04	
A 61 P	17/00	
A 61 P	1/16	
A 61 P	25/00	
A 61 P	21/00	
A 61 P	13/12	
A 61 P	15/00	
A 61 P	19/04	
A 61 P	11/00	
A 61 P	9/10	

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月26日(2012.10.26)

【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

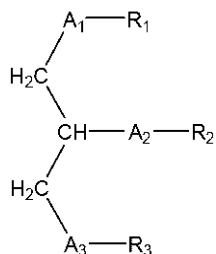
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の式を有する化合物：



またはその立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物、またはその医薬的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和物、または水和物、ただし、上記式において、

(i)  $\text{A}_1$ 、 $\text{A}_2$  および  $\text{A}_3$  はそれぞれが独立して、O および S からなる群から選択される；

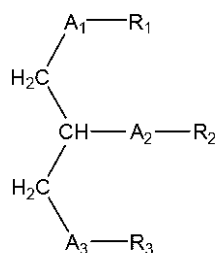
(ii)  $\text{R}_1$  は、長さが2個～28個の炭素であるアルキル鎖である；および

(iii)  $\text{R}_2$  は、(3-カルボキシ)プロピル、(6-カルボキシ)ヘキサニル、(2-カルボキシ)エチルからなる群から選択される；および

(iv)  $\text{R}_3$  は、H、アシル、アルキル、ホスファート、ホスホコリン、ホスホエタノールアミン、ホスホエタノールアミン-N-グルタル酸、ホスホセリンおよびホスホイノシトールからなる群から選択される。

【請求項2】

下記の式を有する化合物：

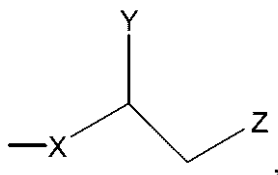


またはその立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物、またはその医薬的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和物、または水和物、ただし、上記式において、

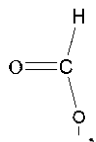
(i)  $\text{A}_1$ 、 $\text{A}_2$  および  $\text{A}_3$  はそれぞれが独立して、O および S からなる群から選択される；

(ii)  $\text{R}_1$  は長さが2個～28個の炭素であるアルキル鎖である；および

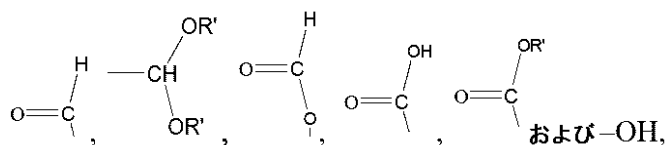
(iii)  $\text{R}_2$  は



であり、上記式において、XはC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>のアルキルであり、Yは、



-OH、-H、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、アセトキシおよび芳香族官能基からなる群から選択される；および、  
Zは、

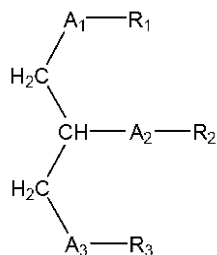


からなる群から選択され、ただし、これらの式において、R'はC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである；および

(iV) R<sub>3</sub>は、ホスホエタノールアミン-N-グルタル酸およびホスホセリンからなる群から選択される。

【請求項3】

下記の式を有する化合物：

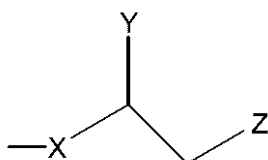


またはその立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物、またはその医薬的に許容される塩、プロドラッグ、溶媒和物、または水和物、ただし、上記式において、

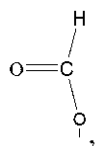
(i) A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>およびA<sub>3</sub>はそれぞれが独立して、OおよびSからなる群から選択される；

(ii) R<sub>1</sub>は、ドデシル、オクタデシル、オクチル、エイコサニル、cis-9-ヘキサデセニル、(2-オクチル)ドデシルおよび(15-カルボキシ)ペンタデシルからなる群から選択される；

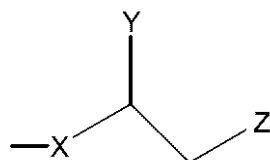
(iii) R<sub>2</sub>は、長さが2個～28個の炭素であるアルキル鎖、および、下記の基：



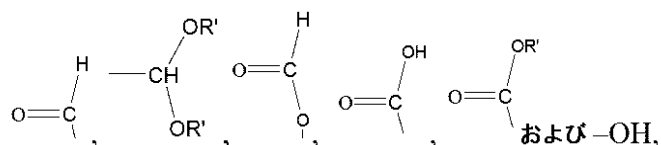
であり、上記式において、XはC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>のアルキルであり、Yは、



- OH、- H、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、アセトキシおよび芳香族官能基からなる群から選択され、ただし、 $R_1$  が (15 - カルボキシ) ペンタデシル以外であるならば、 $R_2$  は、前記



であり、  
Z は、



からなる群から選択され、ただし、これらの式において、 $R'$  は  $C_1 \sim 4$  アルキルである；および

(iv)  $R_3$  は、H、アシル、アルキル、ホスファート、ホスホコリン、ホスホエタノールアミン、ホスホエタノールアミン - N - グルタル酸、ホスホセリンおよびホスホイノシトールからなる群から選択される。

【請求項 4】

$A_1$  は S であり、 $A_2$  および  $A_3$  はそれぞれ O である、請求項 3 に記載の化合物、その立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物。

【請求項 5】

$R_2$  は、(4 - メチルカルボキシ) ブチル、(3 - カルボキシ) プロピル、(6 - カルボキシ) ヘキサニル、(2 - カルボキシ) エチル、5, 6 - ジヒドロキシヘキサニル, 5, 5 - ジエトキシペンチルおよび 5, 5 - ジメトキシペンチルからなる群から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

請求項 3 または 5 に記載の化合物、またはその立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物であって、化合物が下記の化合物からなる群から選択される、化合物：

1 - ドデシル - 2 - (4 - カルボキシ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン (C I - 209) ；

1 - (15' - カルボキシ) ペンタデシル - 2 - (4 - カルボキシ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン (C I - 213) ；

1 - (15' - カルボキシ) ペンタデシル - 2 - (4 - カルボキシ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホエタノールアミン (C I - 214) ；

1 - オクタデシル - 2 - (4 - カルボキシ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン (C I - 215) ；

1 - オクタデシル - 2 - (4 - カルボキシ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホエタノールアミン (C I - 216) ；

1 - (シス - 9 - ヘキサデセニル) - 2 - (4 - カルボキシ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ；

1 - オクチル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ( C I - 2 0 7 ) ;

1 - オクチル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホエタノールアミン ;

1 - エイコサニル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ( C I - 2 1 9 ) ;

1 - エイコサニル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホエタノールアミン ; ( C I - 2 2 0 ) ;

1 - ( 2 - オクチル ) ドデシル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ( V B - 2 2 1 ) ; および

1 - ( 2 - オクチル ) ドデシル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホエタノールアミン ( V B - 2 2 2 ) 。

【請求項 7】

請求項 6 に記載の化合物、またはその立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物であって、化合物が 1 - ( 2 - オクチル ) ドデシル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ( V B - 2 2 1 ) である、化合物。

【請求項 8】

請求項 6 に記載の化合物、またはその立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物であって、化合物が 1 - エイコサニル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ( C I - 2 1 9 ) である、化合物。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物、またはその立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物であって、化合物が下記の化合物からなる群から選択される、化合物 ;

1 - ヘキサデシル - 2 - ( 3 - カルボキシ ) プロピル - グリセロ - 3 - ホスホエタノールアミン ( C I - 2 0 6 ) ;

1 - ヘキサデシル - 2 - ( 3 - カルボキシ ) プロピル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ( C I - 2 0 5 ) ;

1 - ヘキサデシル - 2 - ( 6 - カルボキシ ) ヘキサニル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ( C I - 2 0 3 ) ; および

1 - ヘキサデシル - 2 - ( 2 - カルボキシ ) エチル - グリセロ - 3 - ホスホコリン ( C I - 2 1 7 ) 。

【請求項 10】

請求項 2 に記載の化合物、またはその立体異性体、光学異性体、鏡像異性体、ラセミ混合物、または立体異性体混合物であって、化合物が下記の化合物からなる群から選択される、化合物 ;

1 - ヘキサデシル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホエタノールアミン - N - グルタル酸 ( C I - 2 1 0 ) ; および、

1 - ヘキサデシル - 2 - ( 4 - カルボキシ ) ブチル - グリセロ - 3 - ホスホセリン ( V B - 2 2 3 ) 。

【請求項 11】

内因性の酸化脂質に伴う炎症を処置または防止する方法における使用のために特定される、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 12】

インターロイキン - 1 2 およびインターロイキン - 2 3 からなる群から選択されるサイトカインのレベルを低下させる方法における使用のために特定される、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 13】

インターロイキン - 1 2 およびインターロイキン - 2 3 からなる群から選択されるサイ

トカインのレベルを低下させることが有益である疾患または障害を処置する方法における使用のために特定される、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物を有効成分として含み、かつ、医薬的に許容されるキャリアを含む医薬組成物。

【請求項 15】

包装材で包装され、内因性の酸化脂質に伴う炎症の処置または防止における使用のために前記包装材の内部または表面において印刷で特定される、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

包装材で包装され、インターロイキン - 12 およびインターロイキン - 23 からなる群から選択されるサイトカインのレベルを低下させるために前記包装材の内部または表面において印刷で特定される、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

包装材で包装され、インターロイキン - 12 およびインターロイキン - 23 からなる群から選択されるサイトカインのレベルを低下させることが有益である疾患または障害の処置における使用のために前記包装材の内部または表面において印刷で特定される、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

内因性の酸化脂質に伴う炎症を処置または防止する方法に使用するための請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物であって、前記方法が、治療効果的な量の化合物をその必要性のある対象に投与し、それにより、内因性の酸化脂質に伴う炎症を前記対象において処置または防止することを含む、化合物。

【請求項 19】

インターロイキン - 12 およびインターロイキン - 23 からなる群から選択されるサイトカインのレベルを対象において低下させる方法に使用するための請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物であって、前記方法が、効果的な量の化合物を対象に投与することを含む、化合物。

【請求項 20】

インターロイキン - 12 およびインターロイキン - 23 からなる群から選択されるサイトカインのレベルを低下させることが有益である疾患または障害を処置する方法に使用するための請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物であって、前記方法が、効果的な量の化合物をその必要性のある対象に投与することを含む、化合物。

【請求項 21】

内因性の酸化脂質に伴う炎症を処置または防止するための医薬品の製造における、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 22】

インターロイキン - 12 およびインターロイキン - 23 からなる群から選択されるサイトカインのレベルを対象において低下させるための医薬品の製造における、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 23】

インターロイキン - 12 およびインターロイキン - 23 からなる群から選択されるサイトカインのレベルを低下させることが有益である疾患または障害を処置するための医薬品の製造における、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 24】

前記炎症は、特発性の炎症性疾患または炎症性障害、慢性の炎症性疾患または炎症性障害、急性の炎症性疾患または炎症性障害、自己免疫疾患または自己免疫障害、感染性疾患または感染性障害、炎症性の悪性疾患または悪性障害、炎症性の移植関連疾患または移植関連障害、炎症性の変性疾患または変性障害、過敏性に伴う疾患または障害、炎症性の心臓血管疾患または心臓血管障害、炎症性の脳血管疾患または脳血管障害、末梢血管疾患ま

たは末梢血管障害、炎症性の腺疾患または腺障害、炎症性の胃腸疾患または胃腸障害、炎症性の皮膚疾患または皮膚障害、炎症性の肝疾患または肝障害、炎症性の神経学的疾患または神経学的障害、炎症性の筋骨格疾患または筋骨格障害、炎症性の腎疾患または腎障害、炎症性の生殖疾患または生殖障害、炎症性の全身疾患または全身障害、炎症性の結合組織疾患または結合組織障害、炎症性腫瘍、壊死、炎症性のインプラント関連疾患またはインプラント関連障害、炎症性老化プロセス、免疫不全疾患または免疫不全障害、および、炎症性の肺疾患または肺障害からなる群から選択される疾患または障害に伴う、請求項 1 1 に記載の化合物、請求項 1 4 に記載の医薬組成物、請求項 1 8 に記載の化合物、または請求項 2 1 に記載の使用。