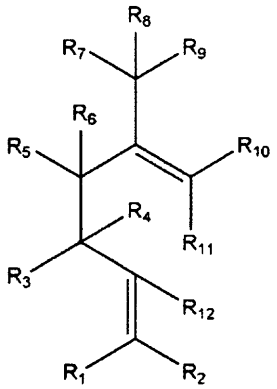
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成23年3月17日(2011.3.17)

【公表番号】特表2010-518030(P2010-518030A)
【公表日】平成22年5月27日(2010.5.27)
【年通号数】公開・登録公報2010-021
【出願番号】特願2009-548553(P2009-548553)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/045　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/047　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/215　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/22　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/02　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/045
Ａ６１Ｋ　31/047
Ａ６１Ｋ　31/215
Ａ６１Ｋ　31/22
Ａ６１Ｐ　25/02

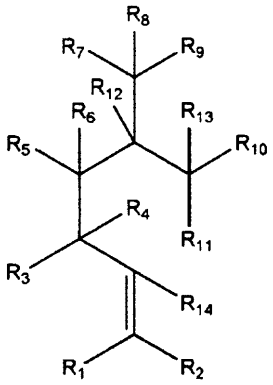
【手続補正書】
【提出日】平成23年1月27日(2011.1.27)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
少なくとも１つのテルペン化合物又は複数のテルペン化合物の組み合わせ、及び、任意で１つ以上の薬学的に許容される希釈剤又は賦形剤を含む、神経伝達を抑制するための組成物であって、
前記テルペン化合物が、ネロール、ゲラニオール、ネラール、ゲラニアール、ギ酸ゲラニル、酪酸ゲラニル、チグリン酸ゲラニル、ギ酸シトロネリル、ギ酸ネリル、イソメントン、酪酸シトロネリル、チグリン酸シトロネリル、メントン、ローズオキサイド、並びにこれらの薬学的に許容される異性体、塩、エステル若しくは溶媒和化合物からなる群から選択される、医薬組成物。
【請求項２】
前記テルペン化合物がゲラニオール、ゲラニアール、メントン、ローズオキサイド、又はこれらの薬学的に許容される塩、エステル若しくは溶媒和化合物である、請求項１に記載の組成物。
【請求項３】
前記テルペン化合物がネロール、ネラール、ギ酸ゲラニル、酪酸ゲラニル、チグリン酸ゲラニル、又はこれらの薬学的に許容される塩、エステル若しくは溶媒和化合物である、請求項１に記載の組成物。
【請求項４】
前記テルペン化合物がギ酸シトロネリル、酪酸シトロネリル、チグリン酸シトロネリル、又はこれらの薬学的に許容される塩、エステル若しくは溶媒和化合物である、請求項１に記載の組成物。

【請求項５】
前記組成物が懸濁液、丸剤、ゲル、オイル、クリーム、パッチ、スプレー又はエアゾールの形態である、請求項１～４のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項６】
哺乳類被験体における、神経の興奮と抑制の不均衡を特徴とする疾患を治療するための、請求項１～５のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項７】
前記哺乳類被験体がヒトである、請求項６に記載の組成物。
【請求項８】
経口投与、局所投与、鼻腔内投与、又は経皮投与に好適である、請求項６または７に記載の組成物。
【請求項９】
前記疾患が神経障害性疼痛である、請求項６～８のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項１０】
前記神経障害性疼痛が、糖尿病性末梢神経障害、帯状疱疹、ヘルペス後神経痛、三叉神経痛、複合性局所疼痛症候群、反射性交感神経ジストロフィ、幻肢症候群、慢性疾患、外傷、インピンジメント、薬物暴露、有毒化学物質暴露、現在の感染、過去の感染、器官機能障害、血管疾患、代謝性疾患、癌、癌治療、自己免疫疾患、線維筋痛症によって起こるか、又は特発性である、請求項９に記載の組成物。
【請求項１１】
前記疾患が、灼熱感及び／又はずきずきする痛み及び／又はしびれ及び／又は刺痛及び／又は異痛を特徴とする疼痛である、請求項６に記載の組成物。
【請求項１２】
少なくとも１つのテルペン化合物又は複数のテルペン化合物の組み合わせ、及び、任意で１つ以上の薬学的に許容される希釈剤又は賦形剤を含む、神経障害性疼痛を治療するための組成物。
【請求項１３】
前記テルペン化合物がテルペン、テルペノイド、又はこれらの薬学的に許容される塩、エステル若しくは溶媒和化合物である、請求項１２に記載の組成物。
【請求項１４】
前記テルペノイドが、テルペノイドアルデヒド、テルペノイド酸、テルペノイドエステル、テルペノイドオキサイドである、請求項１３に記載の組成物。
【請求項１５】
前記テルペン化合物が、ゲラニオール、シトロネロール、ゲラニアール、シトロネラール、リナロール、メントン、ローズオキサイド、α－テルピネオール、又はこれらの薬学的に許容される塩、エステル若しくは溶媒和化合物である、請求項１２に記載の組成物。
【請求項１６】
前記テルペン化合物が、下記式Ｉ又は式ＩＩで表される化合物、又はこれらの薬学的に許容される塩、エステル若しくは水和物である、請求項１２に記載の組成物。

【化１】



式Ｉ



式II

（式中、Ｒ１、Ｒ２、Ｒ３、Ｒ４、Ｒ５、Ｒ６、Ｒ７、Ｒ８、Ｒ９、Ｒ１０、Ｒ１１、Ｒ１２、Ｒ１３及びＲ１４は、独立して、Ｈ、ＯＨ、ＣＯＯＨ、ＣＯＯＣＨ３、ＣＨ２ＯＨ、ＯＣＯＨ、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アルキル基、Ｃ１～Ｃ２０分岐アルキル基、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アルコキシ基、Ｃ１～Ｃ２０分岐アルコキシ基、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アシルオキシ基、及びＣ１～Ｃ２０分岐アシルオキシ基、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アリル基、及びＣ１～Ｃ２０分岐アリル基から選択されるか、又は、Ｒ３とＲ４、Ｒ５とＲ６、Ｒ７とＲ８、又はＲ１０とＲ１１の１つ以上は、一緒に＝Ｏを形成し、
アルキル基、アルコキシ基、アシルオキシ基、及びアリル基は、任意で、アリール、アミン、アミド、ハライド、ホスフェート、又はチオールで置換されている）

【請求項１７】
式Ｉで表される化合物（式中、Ｒ１、Ｒ２、Ｒ３、Ｒ４、Ｒ５、Ｒ６、Ｒ７、Ｒ８、Ｒ９、及びＲ１２はＨであり、Ｒ１０及び／又はＲ１１はＨ、ＯＨ、ＣＯＯＨ、ＣＯＯＣＨ３、ＣＨ２ＯＨ、ＯＣＯＨ、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アルキル基、Ｃ１～Ｃ２０分岐アルキル基、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アルコキシ基、Ｃ１～Ｃ２０分岐アルコキシ基、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アシルオキシ基、及びＣ１～Ｃ２０分岐アシルオキシ基、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アリル基、及びＣ１～Ｃ２０分岐アリル基から選択されるか、又は、Ｒ１０とＲ１１は一緒に＝Ｏである）を含む、請求項１６に記載の組成物。

【請求項１８】
ゲラニアール（３，７－ジメチル－２，６－オクタジエナール）、
ネラール（ｃｉｓ３，７－ジメチル－２，６－オクタジエナール）、
ゲラニオール（２，６－オクタジエン－１－オール　３，７－ジメチル－　（２Ｅ）－）、
ネロール（ｃｉｓ－３，７－ジメチル－２，６－オクタジエン－１－オール）、
ギ酸ゲラニル（２，６－オクタジエン－１－オール　３，７－ジメチル－　ホルメート、（２Ｅ）－）
酪酸ゲラニル（酪酸　（２Ｅ）－３，７－ジメチル－２，６－オクタジエニルエステル）、
チグリン酸ゲラニル（２－ブテン酸　２－メチル－（２Ｅ）－３，７－ジメチル－２，６－オクタジエニルエステル　（２Ｅ）－）、
である式Ｉで表される１つ以上の化合物、又はこれらの薬学的に許容される異性体、塩、エステル若しくは溶媒和化合物を含む、請求項１６に記載の組成物。

【請求項１９】
式ＩＩで表される化合物（式中、Ｒ１、Ｒ２、Ｒ３、Ｒ４、Ｒ５、Ｒ６、Ｒ７、Ｒ８、Ｒ９、Ｒ１２、Ｒ１３及びＲ１４はＨであり、Ｒ１０及び／又はＲ１１はＨ、ＯＨ、ＣＯＯＨ、ＣＯＯＣＨ３、ＣＨ２ＯＨ、ＯＣＯＨ、Ｃ１～Ｃ２０非分岐アルキル基、Ｃ１～Ｃ

$_{20}$分岐アルキル基、C_1～C_{20}非分岐アルコキシ基、C_1～C_{20}分岐アルコキシ基、C_1～C_{20}非分岐アシルオキシ基、及びC_1～C_{20}分岐アシルオキシ基、C_1～C_{20}非分岐アリル基、及びC_1～C_{20}分岐アリル基から選択されるか、又は、R_{10}とR_{11}は一緒に＝Ｏである）を含む、請求項１６に記載の組成物。

【請求項２０】

シトロネラール（３，７－ジメチル－６－オクテン－１－アール）、

シトロネロール（３，７－ジメチルオクタ－６－エン－１－オール）、

ギ酸シトロネリル（６－オクテン－１－オール　３，７－ジメチル－　ホルメート）

酪酸シトロネリル（酪酸　３，７－ジメチル－６－オクテニルエステル）、

チグリン酸シトロネリル（２－ブテン酸　２－メチル－３，７－ジメチル－６－オクテニルエステル　（２Ｅ）－）、

である式ＩＩで表される１つ以上の化合物、又はこれらの薬学的に許容される異性体、塩、エステル若しくは溶媒和化合物を含む、請求項１６に記載の組成物。

【請求項２１】

哺乳類被験体の神経障害性疼痛を治療するための、請求項１２～２０のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項２２】

前記哺乳類被験体がヒトである、請求項２１に記載の組成物。

【請求項２３】

懸濁液、丸剤、ゲル、オイル、クリーム、パッチ、スプレー又はエアゾールの形態である、請求項１２～２２のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項２４】

経口投与、局所投与、鼻腔内投与、又は経皮投与に好適である、請求項１２～２３のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項２５】

前記神経障害性疼痛が、糖尿病性末梢神経障害、帯状疱疹、ヘルペス後神経痛、三叉神経痛、複合性局所疼痛症候群、反射性交感神経ジストロフィ、幻肢症候群、慢性疾患、外傷、インピンジメント、薬物暴露、有毒化学物質暴露、現在の感染、過去の感染、器官機能障害、血管疾患、代謝性疾患、癌、癌治療、自己免疫疾患、線維筋痛症によって起こるか、又は特発性である、請求項１２～２４のいずれか一項に記載の組成物。