

【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19年4月5日(2007.4.5)

【公表番号】特表2002-531543(P2002-531543A)

【公表日】平成14年9月24日(2002.9.24)

【出願番号】特願2000-586684(P2000-586684)

【国際特許分類】

C 0 7 C 323/59 (2006.01)

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 P 5/50 (2006.01)

A 6 1 P 7/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

C 0 7 D 307/60 (2006.01)

C 0 7 K 1/02 (2006.01)

C 0 7 K 2/00 (2006.01)

C 0 7 K 7/16 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 323/59

A 6 1 K 31/198

A 6 1 P 5/50

A 6 1 P 7/12

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/00

C 0 7 D 307/60 Z

C 0 7 K 1/02

C 0 7 K 2/00

C 0 7 K 7/16

A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年2月13日(2007.2.13)

【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

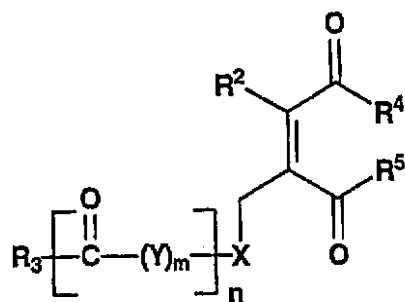
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式Iの化合物であって：

【化1】



I

ここで、 R^2 は、水素、低級アルキルまたはアリールからなる群から選択され、ここで、該低級アルキルまたはアリールは、1つ以上のアルコキシ、アルカノイル、ニトロ、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アシルオキシ、低級アルキルまたはハロゲン原子で必要に応じて置換され；

R^3 は、親油性基であり；

R^4 および R^5 の一方は、アミン含有薬物、天然または非天然アミノ酸、ペプチドおよびタンパク質からなる群から選択される生物学的に活性なアミノ基含有物質であり、そして R^4 および R^5 の他方は、 OR^6 であり、ここで R^6 は、水素、アルカリ金属および陰電荷からなる群から選択され；

Xは、酸素または硫黄であり；

Yは、天然または非天然架橋アミノ酸であり；

nは、0または1であり；そして

mは、0～10の整数である、化合物。

【請求項2】 R^2 がメチルであり、そしてXが硫黄である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】 $n = 0$ 、 $m = 0$ 、そして R^3 が、4～26個の炭素原子を有する直鎖または分枝鎖の炭化水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】 前記直鎖または分枝鎖の炭化水素が、5～19個の炭素原子を有する、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】 前記直鎖または分枝鎖の炭化水素が、カルボニル基と一緒に、パルミチル、オレイル、ステアシル、ラウリル、ミリスチル、コレートおよびデオキシコレートからなる群から選択される、請求項4に記載の化合物。

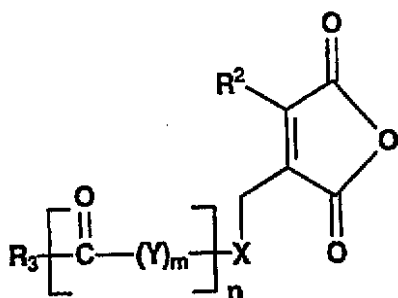
【請求項6】 前記天然または非天然アミノ酸が、天然に存在するアミノ酸である、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】 前記アミン含有薬物がチラミンである、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】 前記ペプチドが、Arg、バソプレシンおよびインス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9】 一般式IIの化合物であって：

【化2】



II

ここで、 R^2 は、水素、低級アルキルまたはアリールからなる群から選択され、ここで、該低級アルキルまたはアリールは、1つ以上のアルコキシ、アルカノイル、ニトロ、シク

ロアルキル、アルケニル、アルキニル、アシルオキシ、低級アルキルまたはハロゲン原子で必要に応じて置換され；

R^3 は、親油性基であり；

X は、酸素または硫黄であり；

Y は、天然または非天然架橋アミノ酸であり；

n は、0 または 1 であり；そして

m は、0 ~ 10 の整数である、
化合物。

【請求項 10】 R^2 がメチルであり、そして X が硫黄である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】 $n = 0$ 、 $m = 0$ 、そして R^3 が、4 ~ 26 個の炭素原子を有する直鎖または分枝鎖の炭化水素である、請求項 9 に記載の化合物。

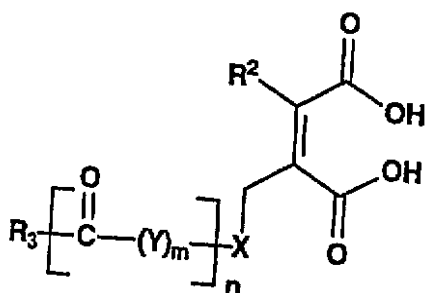
【請求項 12】 前記直鎖または分枝鎖の炭化水素が、5 ~ 19 個の炭素原子を有する、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】 前記直鎖または分枝鎖の炭化水素が、隣接するカルボニル基と一緒に、パルミチル、オレイル、ステアリル、コレートおよびデオキシコレートからなる群から選択される、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 14】 前記天然または非天然アミノ酸が、天然に存在するアミノ酸である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 15】 一般式 III の化合物またはその薬学的に受容可能な塩であって：

【化 3】



III

ここで、 R^2 は、水素、低級アルキルまたはアリールからなる群から選択され、ここで、該低級アルキルまたはアリールは、1 つ以上のアルコキシ、アルカノイル、ニトロ、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アシルオキシ、低級アルキルまたはハロゲン原子で必要に応じて置換され；

R^3 は、親油性基であり；

X は、酸素または硫黄であり；

Y は、天然または非天然架橋アミノ酸であり；

n は、0 または 1 であり；そして

m は、0 ~ 10 の整数である、
化合物。

【請求項 16】 R^2 がメチルであり、そして X が硫黄である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】 $n = 0$ 、 $m = 0$ 、そして R^3 が、4 ~ 26 個の炭素原子を有する直鎖または分枝鎖の炭化水素である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 18】 前記直鎖または分枝鎖の炭化水素が、5 ~ 19 個の炭素原子を有する、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】 前記直鎖または分枝鎖の炭化水素が、隣接するカルボニル基と一緒に、ラウリル、ミリスチル、パルミチル、オレイル、ステアリル、コレートおよびデオキシコレートからなる群から選択される、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】 前記天然または非天然アミノ酸が、天然に存在するアミノ酸である

、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 21】 アミン含有薬物、ペプチドおよびタンパク質からなる群から選択されるアミン含有物質の細胞吸収を増加するための組成物であって、請求項 1 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 22】 アミン含有薬物、ペプチドおよびタンパク質からなる群から選択される生物学的に活性なアミン含有化合物の、哺乳動物における血液および組織保持を延長するための組成物であって、請求項 1 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 23】 請求項 1 に記載の化合物を形成する方法であって、該方法が、アミン含有薬物、ペプチドおよびタンパク質からなる群から選択される生物学的に活性なアミノ基含有物質を、請求項 1 に記載の化合物が得られる条件下で、請求項 9 に記載の化合物と反応させる工程を包含する、方法。

【請求項 24】 生物学的に活性なアミノ基含有物質を、細胞の内部へ送達するための組成物であって、請求項 1 に記載の化合物を含む、ここで該化合物は、該細胞により吸収され、そして該細胞内で、アミド結合を加水分解し、そして該生物学的に活性なアミノ基含有物質を放出するのに十分低い pH に暴露される、組成物。

【請求項 25】 薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、以下：

(a) 有効量の請求項 1 に記載の化合物；および

(b) 薬学的に受容可能なキャリア、

を含む、薬学的組成物。

【請求項 26】 請求項 25 に記載の薬学的調製物であって、ここで、前記組成物が、前記化合物をアミド結合の加水分解から保護する腸溶性コーティングを含み、これにより前記生物学的に活性なアミノ基含有物質の放出を、該コーティングが除去されるかまたは溶解するまで防止する、薬学的調製物。