

【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13日(2012.12.13)

【公表番号】特表2012-507521(P2012-507521A)

【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2011-534525(P2011-534525)

【国際特許分類】

C 07 J	9/00	(2006.01)
A 61 K	31/575	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	1/00	(2006.01)
A 23 L	1/30	(2006.01)
C 12 N	1/20	(2006.01)

【F I】

C 07 J	9/00	C S P
A 61 K	31/575	
A 61 K	45/00	
A 61 P	31/04	
A 61 P	43/00	1 2 1
A 61 P	1/00	
A 23 L	1/30	Z
C 12 N	1/20	E

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月29日(2012.10.29)

【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

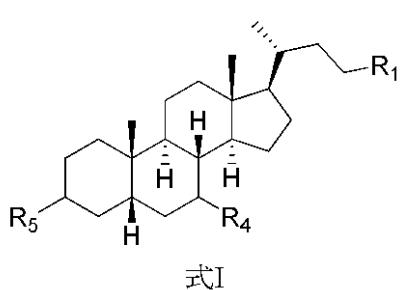
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物：

【化1】



R<sub>1</sub>が-CO-NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(R<sub>3</sub>)であり；

$R_4$  および  $R_5$  が、それぞれ独立して、-H、-OH、-O( $R_2$ )、および-Oアシルからなる群より選択され、

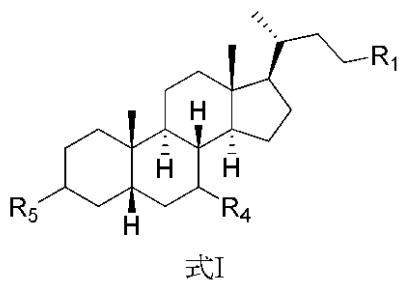
$R_2$  が、それぞれ独立して、直鎖または分岐鎖C1～C10アルキルであり；

$R_3$  が、-CONH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、および-CO<sub>2</sub>( $R_2$ )からなる群より選択される。

【請求項2】

式Iの化合物：

【化2】



$R_1$  が -CON( $R_2$ )CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>( $R_3$ )であり；

$R_4$  および  $R_5$  は、それぞれ独立して、-H、-OH、-O( $R_2$ )、および-Oアシルからなる群より選択され、

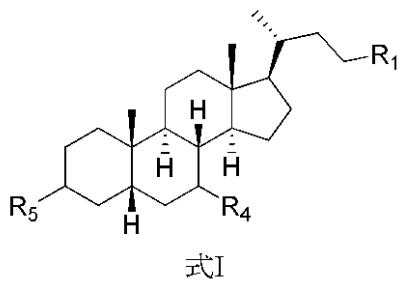
$R_2$  が、それぞれ独立して、直鎖または分岐鎖C1～C10アルキルであり；

$R_3$  が、-CONH<sub>2</sub>および-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>からなる群より選択される。

【請求項3】

式Iの化合物：

【化3】



$R_1$  が -CON( $R_2$ )CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>( $R_3$ )であり；

$R_4$  および  $R_5$  が、それぞれ独立して、-H、-OH、-O( $R_2$ )、および-Oアシルからなる群より選択され、

$R_2$  が、それぞれ独立して、直鎖または分岐鎖C1～C10アルキルであり；

$R_3$  が -SO<sub>3</sub>( $R_2$ ) および -CO<sub>2</sub>( $R_2$ ) からなる群より選択され；

$R_4$  が -H または -OH のいずれかであるとき、 $R_5$  が -H、-O( $R_2$ )、および-Oアシルからなる群より選択され；

$R_4$  が -O( $R_2$ ) または -Oアシルのいずれかであるとき、 $R_5$  が、-H、-OH、-O( $R_2$ )、および-Oアシルからなる群より選択される。

【請求項4】

一次胆汁塩を二次胆汁塩に代謝することができる少なくとも1つの細菌株を含む、プロバイオティクス組成物。

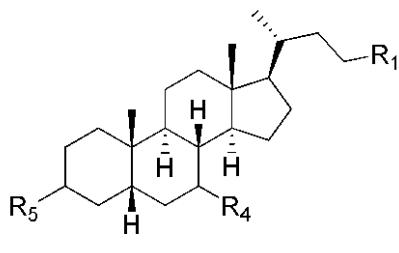
## 【請求項 5】

前記少なくとも1つの細菌株が、クロストリジウム・シンデンス、クロストリジウム・レプタムおよびクロストリジウム・ヒラノニスからなる群より選択されることを特徴とする請求項4記載のプロバイオティクス組成物。

## 【請求項 6】

哺乳動物被験体における、クロストリジウム・ディフィシレ関連疾患を予防するための組成物であって、下記式Iの化合物、またはその薬学的に許容される塩を含み、C.ディフィシレ関連疾患を発症する危険性のある哺乳動物被験体に有効量で投与され、該被験体におけるC.ディフィシレの胞子の発芽を阻害して、クロストリジウム・ディフィシレ関連疾患を予防することを特徴とする組成物：

## 【化4】



式I

R<sub>1</sub>が、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(R<sub>2</sub>)、-CONH<sub>2</sub>、-CON(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、-CONHC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>(R<sub>3</sub>)、-CON(R<sub>2</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(R<sub>3</sub>)、-NH<sub>2</sub>、-NH(R<sub>2</sub>)、および-N(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>からなる群より選択され；

R<sub>4</sub>およびR<sub>5</sub>が、それぞれ独立して、-H、-NH<sub>2</sub>、-NH(R<sub>2</sub>)、-N(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、-OH、-O(R<sub>2</sub>)、および-Oアシルからなる群より選択され、ここで：

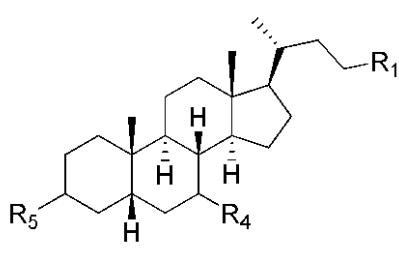
R<sub>2</sub>が、それぞれ独立して、直鎖または分岐鎖C1～C10アルキルであり；

R<sub>3</sub>が、-CO<sub>2</sub>H、-SO<sub>3</sub>H、-CONH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>(R<sub>2</sub>)、および-SO<sub>3</sub>(R<sub>2</sub>)からなる群より選択される。

## 【請求項 7】

哺乳動物被験体におけるクロストリジウム・ディフィシレ関連疾患を治療するための組成物であって、下記式Iの化合物、またはその薬学的に許容される塩を含み、C.ディフィシレ関連疾患を有する哺乳動物被験体に有効量で投与され、該被験体におけるC.ディフィシレの増殖を阻害して、C.ディフィシレ関連疾患を治療することを特徴とする組成物：

## 【化5】



式I

R<sub>1</sub>は、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(R<sub>2</sub>)、-CONH<sub>2</sub>、-CON(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、-CONHC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>(R<sub>3</sub>)、-CON(R<sub>2</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(R<sub>3</sub>)、-NH<sub>2</sub>、-NH(R<sub>2</sub>)、およ

び - N ( R<sub>2</sub> )<sub>2</sub> からなる群より選択され、

R<sub>4</sub> および R<sub>5</sub> が、それぞれ独立して、 - H 、 - NH<sub>2</sub> 、 - NH ( R<sub>2</sub> ) 、 - N ( R<sub>2</sub> )<sub>2</sub> 、 - OH 、 - O ( R<sub>2</sub> ) 、および - O アシルからなる群より選択され、

ここで：

R<sub>2</sub> が、それぞれ独立して、直鎖または分岐鎖 C<sub>1</sub> ~ C<sub>10</sub> アルキルであり、

R<sub>3</sub> が - CO<sub>2</sub>H 、 - SO<sub>3</sub>H 、 - CONH<sub>2</sub> 、 - SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> 、 - CO<sub>2</sub>( R<sub>2</sub> ) 、および - SO<sub>3</sub>( R<sub>2</sub> ) からなる群より選択される。

【請求項 8】

R<sub>1</sub> が、 - CO<sub>2</sub>H 、 - CONH<sub>2</sub> 、 - CON ( R<sub>2</sub> )<sub>2</sub> 、 - CONHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>( R<sub>3</sub> ) 、および - CON ( R<sub>2</sub> )CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>( R<sub>3</sub> ) からなる群より選択され；

R<sub>4</sub> および R<sub>5</sub> が、それぞれ独立して、 - H 、 - OH 、 - O ( R<sub>2</sub> ) 、および - O アシルからなる群より選択されることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

【請求項 9】

式 I の化合物が、ケノデオキシコール酸またはそれらの薬学的に許容される塩であることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

【請求項 10】

式 I の化合物が、ウルソデオキシコール酸またはそれらの薬学的に許容される塩であることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

【請求項 11】

R<sub>1</sub> が - CONHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>( R<sub>3</sub> ) であり；

R<sub>3</sub> が、 - CONH<sub>2</sub> 、 - SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> 、および - CO<sub>2</sub>( R<sub>2</sub> ) からなる群より選択されることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

【請求項 12】

R<sub>1</sub> が - CON ( R<sub>2</sub> )CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>( R<sub>3</sub> ) であり；

R<sub>3</sub> が、 - CONH<sub>2</sub> および - SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> からなる群より選択されることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

【請求項 13】

R<sub>1</sub> が - CON ( R<sub>2</sub> )CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>( R<sub>3</sub> ) であり；

R<sub>3</sub> が - SO<sub>3</sub>( R<sub>2</sub> ) および - CO<sub>2</sub>( R<sub>2</sub> ) からなる群より選択され、

ここで：

R<sub>4</sub> が - H または - OH のいずれかであるとき、R<sub>5</sub> が、 - H 、 - O ( R<sub>2</sub> ) 、および - O アシルからなる群より選択され；

R<sub>4</sub> が - O ( R<sub>2</sub> ) または - O アシルのいずれかであるとき、R<sub>5</sub> が - H 、 - OH 、 - O ( R<sub>2</sub> ) 、および - O アシルからなる群より選択されることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

【請求項 14】

前記 C . ディフィシレ関連疾患が、C . ディフィシレ大腸炎であることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

【請求項 15】

前記 C . ディフィシレ関連疾患が、偽膜性大腸炎であることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

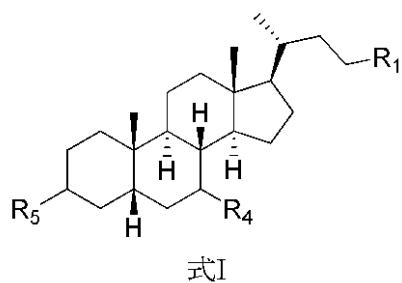
【請求項 16】

前記被験体がヒトであることを特徴とする請求項 7 記載の組成物。

【請求項 17】

抗生素質の治療を受けている哺乳動物被験体におけるクロストリジウム・ディフィシレ関連疾患を発症する危険性を低減するための組成物であって、下記式 I の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含み、抗生素質の治療を受けておりかつ C . ディフィシレ関連疾患を発症する危険性のある哺乳動物被験体に有効量で投与され、該被験体における C . ディフィシレの胞子の発芽を阻害して、クロストリジウム・ディフィシレ関連疾患を発症する危険性を低減することを特徴とする組成物：

## 【化6】



$R_1$ が、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(R<sub>2</sub>)、-CONH<sub>2</sub>、-CON(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、-CONHC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>(R<sub>3</sub>)、-CON(R<sub>2</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(R<sub>3</sub>)、-NH<sub>2</sub>、-NH(R<sub>2</sub>)、および-N(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>からなる群より選択され；

$R_4$ および $R_5$ が、それぞれ独立して、-NH<sub>2</sub>、-NH(R<sub>2</sub>)、-N(R<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、-OH、-O(R<sub>2</sub>)、および-Oアシルからなる群より選択され、ここで：

$R_2$ が、それぞれ独立して、直鎖または分岐鎖C1～C10アルキルであり；

$R_3$ が、-CO<sub>2</sub>H、-SO<sub>3</sub>H、-CONH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>(R<sub>2</sub>)、および-SO<sub>3</sub>(R<sub>2</sub>)からなる群より選択される。

## 【請求項18】

哺乳動物被験体におけるクロストリジウム・ディフィシレの増殖を阻害するための組成物であって、一次胆汁塩を二次胆汁塩に代謝することができる少なくとも1つの細菌株を含むプロバイオティクスを含み、C.ディフィシレの増殖を阻害するために、有効量で、それらを必要とする哺乳動物被験体に投与されることを特徴とする組成物。

## 【請求項19】

哺乳動物被験体におけるクロストリジウム・ディフィシレ関連疾患を予防するための組成物であって、一次胆汁塩を二次胆汁塩に代謝することができる少なくとも1つの細菌株を含むプロバイオティクスを含み、C.ディフィシレ関連疾患を発症する危険性のある哺乳動物被験体に有効量で投与され、該被験体におけるC.ディフィシレの増殖を阻害して、クロストリジウム・ディフィシレ関連疾患を予防することを特徴とする組成物。

## 【請求項20】

哺乳動物被験体におけるクロストリジウム・ディフィシレ関連疾患を治療するための組成物であって、一次胆汁塩を二次胆汁塩に代謝することができる少なくとも1つの細菌株を含むプロバイオティクスを含み、C.ディフィシレ関連疾患有する哺乳動物被験体に有効量で投与され、該被験体におけるC.ディフィシレの増殖を阻害して、C.ディフィシレ関連疾患を治療することを特徴とする組成物。