

【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 18 年 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2004-537498 (P2004-537498A)

【公表日】平成 16 年 12 月 16 日 (2004.12.16)

【年通号数】公開・登録公報 2004-049

【出願番号】特願 2002-544008 (P2002-544008)

【国際特許分類】

C 0 7 F 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/6615 (2006.01)

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 41/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 9/10 B

A 6 1 K 31/6615

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/10 1 0 3

A 6 1 P 41/00

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 6 月 10 日 (2005.6.10)

【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

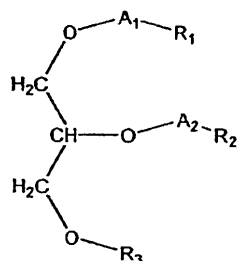
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 下記の式を有する化合物またはその薬学的に受容可能な塩：

【化 1】

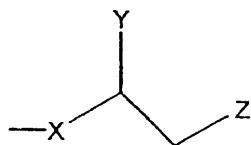


式中、

(i) A_1 および A_2 はそれぞれが独立して、 CH_2 および $\text{C}=\text{O}$ からなる群から選択され、かつ A_1 および A_2 の少なくとも 1 つが CH_2 であり；

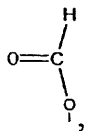
(i i) R_1 および R_2 はそれぞれが独立して、1 炭素 ~ 27 炭素の長さのアルキル鎖、および

【化 2】



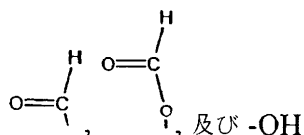
(式中、XはC₁～C₄の鎖であり；Yは、

【化3】



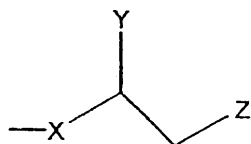
-OH、-H、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、アセトキシおよび芳香族官能基からなる群から選択され；Zは、

【化4】



からなる群から選択される)

からなる群から選択され、R₁およびR₂のうち少なくとも一つは前記

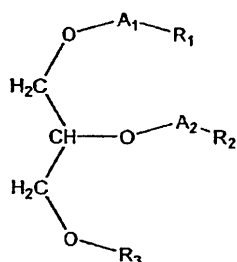


であり；かつ

(iii) R₃は、H、アシル、アルキル、ホスファチジルコリン、ホスファチジルエタノールアミン、ホスファチジルセリン、ホスファチジルカルジオリピンおよびホスファチジルイノシトールからなる群から選択される。

【請求項2】 アテローム性動脈硬化、心臓血管疾患、脳血管疾患、末梢血管疾患、狭窄、再狭窄および/またはステント内狭窄を、その防止および/または処置を必要とする対象において防止および/または処置するための薬学的組成物であって、有効成分として、下記の式を有する群またはその薬学的に受容可能な塩：

【化5】

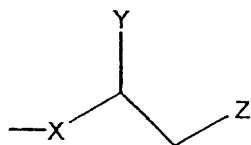


(式中、

(i) A₁およびA₂は独立して、CH₂およびC=Oからなる群から選択され、A₁およびA₂のうち少なくとも一つはCH₂であり；

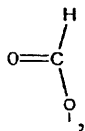
(ii) R₁またはR₂はそれぞれが独立して、1炭素～27炭素の長さのアルキル鎖、および

【化6】



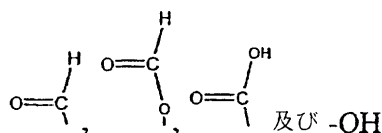
(式中、XはC₁～C₄であり；Yは、

【化7】



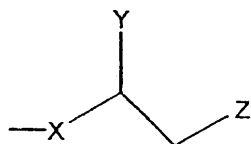
-OH、-H、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、アセトキシおよび芳香族官能基からなる群から選択され；Zは、

【化8】



からなる群から選択される)

からなる群から選択され、R₁およびR₂のうち少なくとも一つは前記



であり；かつ

(iii) R₃は、H、アシル、アルキル、ホスファチジルコリン、ホスファチジルエタノールアミン、ホスファチジルセリン、ホスファチジルカルジオリピンおよびホスファチジリノシトールからなる群から選択される)

から選択される化合物の治療効果的な量と、薬学的に受容可能なキャリアとを含む薬学的組成物。

【請求項3】 粘膜投与によって酸化型LDLに対する寛容性を誘導するために設計される請求項2記載の組成物。

【請求項4】 鼻腔投与、経口投与、または腹腔内投与のために設計される請求項2記載の組成物。

【請求項5】 前記化合物は、前記対象における酸化型LDLに対する免疫反応性を低下させる請求項2記載の組成物。

【請求項6】 アテローム性動脈硬化、心臓血管疾患、脳血管疾患、末梢血管疾患、狭窄、再狭窄および/またはステント内狭窄からなる群から選択される少なくとも1つの障害の防止および/または処置における使用のために包装および識別される請求項2記載の組成物。

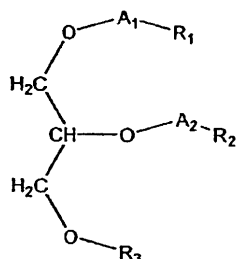
【請求項7】 HMGCoAレダクターゼ阻害剤(スタチン類)、粘膜アジュバント、コルチコステロイド、抗炎症性化合物、鎮痛剤、増殖因子、トキシンおよびさらなる寛容化抗原からなる群から選択される少なくとも1つのさらなる化合物の治療効果的な量をさらに含む請求項2記載の組成物。

【請求項8】 アテローム性動脈硬化、心臓血管疾患、脳血管疾患、末梢血管疾患、狭窄、再狭窄および/またはステント内狭窄からなる群から選択される疾患または症候群または状態を、その防止および/または処置を必要とする対象において防止および/ま

たは処置するための薬学的組成物で、有効成分として合成酸化型LDL誘導体またはその薬学的に受容可能な塩の治療効果的な量を含み、さらに薬学的に受容可能なキャリアを含む組成物。

【請求項9】 アテローム性動脈硬化、心臓血管疾患、脳血管疾患、末梢血管疾患、狭窄、再狭窄および/またはステント内狭窄を、その防止および/または処置を必要とする対象において防止および/または処置する方法で、下記の式を有する群またはその薬学的に受容可能な塩：

【化9】

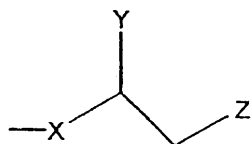


(式中、

(i) A_1 および A_2 は、 CH_2 または $C=O$ であり、 A_1 および A_2 のうち少なくとも一つは CH_2 であり；

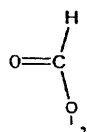
(ii) R_1 または R_2 はそれぞれが独立して、1炭素～27炭素の長さのアルキル鎖、および

【化10】



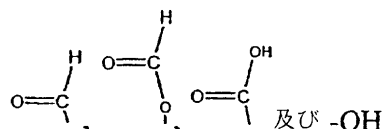
(式中、Xは C_{1-24} の鎖であり；Yは、

【化11】



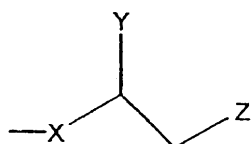
-OH、-H、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、アセトキシおよび芳香族官能基からなる群から選択され；Zは、

【化12】



からなる群から選択される)

からなる群から選択され、 R_1 および R_2 のうち少なくとも一つは前記



であり；かつ

(i i i) R_3 は、H、アシル、アルキル、ホスファチジルコリン、ホスファチジルエタノールアミン、ホスファチジルセリン、ホスファチジルカルジオリピンおよびホスファチジルイノシトールからなる群から選択される)

から選択される化合物の治療効果的な量を投与することを含む方法。

【請求項 10】 前記化合物は粘膜投与によって投与される請求項 9 記載の方法。

【請求項 11】 前記化合物の投与は、鼻腔投与、経口投与、または腹腔内投与である請求項 9 記載の方法。

【請求項 12】 前記化合物の投与により、前記対象における酸化型 LDL に対する免疫反応性が低下させられる請求項 9 記載の方法。

【請求項 13】 前記化合物は、HMGCoA レダクターゼ阻害剤 (スタチン類)、粘膜アジュバント、コルチコステロイド、抗炎症性化合物、鎮痛剤、増殖因子、トキシンおよびさらなる寛容化抗原からなる群から選択される少なくとも 1 つのさらなる化合物の治療効果的な量に加えて投与される請求項 9 記載の方法。

【請求項 14】 酸化型リン脂質を合成する方法であって、

(a) 脂肪酸側鎖の少なくとも 1 つがモノ不飽和脂肪酸 C_{2-15} である 2 つの脂肪酸側鎖を含むリン脂質骨格を提供すること、および

(b) 前記モノ不飽和脂肪酸の二重結合を酸化して、それにより酸化型リン脂質を得ることを含む方法。

【請求項 15】 前記リン脂質骨格は、H、ホスファチジルコリン、ホスファチジルエタノールアミン、ホスファチジルセリン、ホスファチジルカルジオリピンおよびホスファチジルイノシトールからなる群から選択される成分をさらに含む請求項 14 記載の方法。

【請求項 16】 前記モノ不飽和脂肪酸は C_{2-15} である請求項 14 記載の方法。

【請求項 17】 酸化型リン脂質は POVPC であり、前記モノ不飽和脂肪酸は 5 - ヘキセン酸である請求項 14 記載の方法。