

【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】令和3年4月22日(2021.4.22)

【公表番号】特表2020-510678(P2020-510678A)

【公表日】令和2年4月9日(2020.4.9)

【年通号数】公開・登録公報2020-014

【出願番号】特願2019-548677(P2019-548677)

【国際特許分類】

C 0 7 D 311/80 (2006.01)
 A 6 1 K 31/205 (2006.01)
 A 6 1 K 9/48 (2006.01)
 A 6 1 K 47/14 (2006.01)
 A 6 1 P 3/02 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 21/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/06 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)
 A 6 1 P 27/16 (2006.01)
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 21/02 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/366 (2006.01)
 A 2 3 L 33/10 (2016.01)

【 F I 】

C 0 7 D 311/80 C S P
 A 6 1 K 31/205
 A 6 1 K 9/48
 A 6 1 K 47/14
 A 6 1 P 3/02
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 3/06
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 27/16
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 21/02
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 A 6 1 K 31/366
 A 2 3 L 33/10

【手続補正書】

【提出日】令和3年3月8日(2021.3.8)

【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

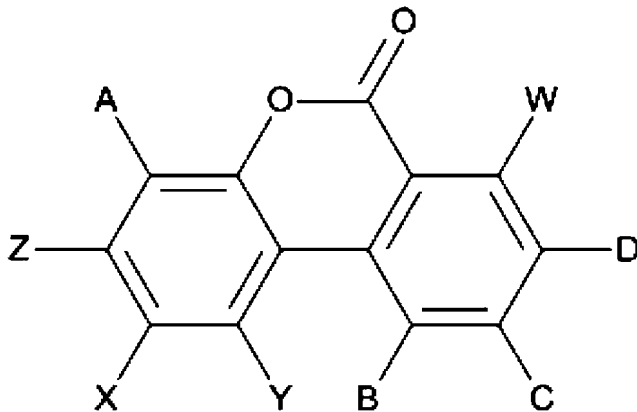
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

対象における状態、疾患、または障害の治療および/または予防に使用するための式(I)の化合物

【化1】



(I)

(式中、A、B、C、D、W、X、Y、およびZがそれぞれ独立して、HおよびOHから選択される)、

またはその塩であって、

前記化合物または塩が、少なくとも21日間にわたって、1日当たり2.8~6.6mgの1日量で対象に経口投与される、式(I)の化合物、またはその塩。

【請求項2】

対象における状態、疾患、または障害の治療および/または予防に使用するための、A、B、C、D、W、X、Y、およびZがそれぞれ独立して、HおよびOHから選択される、前記化合物またはその塩であって、前記化合物または塩が、900~1350ng/mLの式(I)の化合物および/またはその代謝産物のピーク血漿レベルを達成するのに十分な用量で経口投与される、請求項1に記載の式(I)の化合物、またはその塩。

【請求項3】

対象における状態、疾患、または障害の治療および/または予防に使用するための使用するための、A、B、C、D、W、X、Y、およびZがそれぞれ独立して、HおよびOHから選択される、前記化合物またはその塩であって、前記化合物または塩が260~960ng/mLの式(I)の化合物および/またはその代謝産物の定常状態血漿レベルを達成するのに十分な用量で経口投与される、請求項1に記載の式(I)の化合物、またはそ

の塩。

【請求項 4】

前記使用が、対象におけるミトファジーおよび/またはオートファジーを増加させること、ミトコンドリア機能を改善すること、および/または細胞代謝を改善することである、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 5】

前記使用が、対象における筋肉機能および/または性能、身体健康、フィットネス、ATP^{max}、筋肉ATP使用、酸素消費、筋肉生体エネルギー、筋持久力、運動に対する耐性、運動からの回復、および/または持久力の維持および/または改善のうちの一つ以上から選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 6】

前記式(i)の化合物が、食事、栄養、および/または健康補助食品として、食品成分として、または食品に使用される活性成分として投与される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 7】

前記式(i)の化合物が、対象における健康な筋肉機能の維持を助け、筋肉の健康のための栄養サポートを提供し、筋肉中のミトコンドリア発生を支援し、および/または筋肉中のミトコンドリアの健康を支援するために投与される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 8】

前記対象が、健康である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 9】

前記疾患、障害、または状態が、不十分なミトコンドリア活性に関連する疾患、障害、または状態である、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 10】

前記疾患、障害、または状態が、筋肉関連の疾患、障害、または状態である、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 11】

前記疾患、障害、または状態が、老齢に関連する疾患、障害、または状態、例えば、筋肉減少症、悪液質、虚弱、および他の筋肉疾患である、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 12】

前記疾患、障害、または状態が、肥満、代謝率低下、メタボリックシンドローム、代謝ストレス、糖尿病、心血管疾患、高脂血症、記憶力低下、神経変性疾患、認知障害、気分障害、ストレス、および不安障害、脂肪肝疾患、筋骨格疾患および障害、筋肉消耗、筋変性疾患、ミオパチー、加齢に伴う筋肉機能の低下、虚弱、前虚弱、神経筋疾患、デュシェンヌ型筋ジストロフィー、筋肉減少症、筋萎縮および/または悪液質、ICUAW、筋肉喪失、記憶喪失、視力喪失、難聴、関節障害、筋肉機能障害、加齢に伴う筋肉機能の低下、加齢に伴う筋肉減少症、加齢に伴う筋肉消耗、身体疲労、筋肉疲労、封入体筋炎、散発性封入体筋炎、アルコール性肝疾患、非アルコール性脂肪性肝疾患、薬物誘発性肝障害、急性または慢性腎不全、化学療法により誘発される急性または慢性毒性(例えば、腎毒性、神経毒性、聴器毒性)、薬物誘発性渴望、貧血障害、1-抗トリプシン欠乏症、虚血/再灌流傷害、炎症、炎症性腸疾患、クローン病、変形性関節症、アルツハイマー病、パーキンソン病、潰瘍、筋萎縮性側索硬化症、癌、認知障害、ストレス、および気分障害からなる群から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の使用のための化合物または使用。

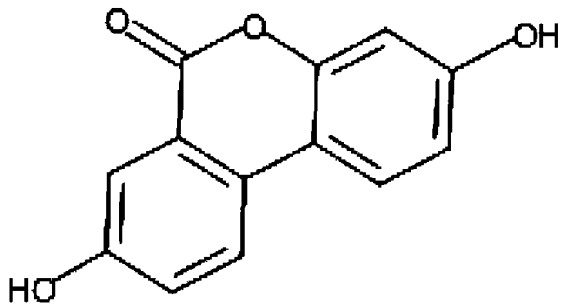
【請求項 13】

前記対象への前記式(I)の化合物の投与が、少なくとも1500pg/mLのC_{max}を含む血漿薬物動態プロファイルをもたらす、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 14】

前記化合物が、ウロリチン A、すなわち、

【化 2】



である、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 15】

前記式 (I) の化合物またはその塩の前記 1 日投与量が、

(i) 4.0 ~ 4.8 mmol の範囲である、

(ii) およそ 4.4 mmol である、または

(iii) およそ 1000 mg である、

のいずれかである、請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 16】

前記対象に、9 ~ 18 mg / kg / 日の範囲の量でウロリチン A を投与することを含む、請求項 1 ~ 15 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 17】

前記式 (I) の化合物またはその塩が、

(i) 少なくとも 28 日間投与される、

(ii) 1 日 1 回投与される、または

(iii) 1 日 2 回投与される、

のいずれかである、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 18】

前記対象が、少なくとも 45 歳である、請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 19】

前記式 (I) の化合物またはその塩が、カルニチンまたはその塩と組み合わせて投与される、請求項 1 ~ 18 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 20】

前記カルニチンまたはその塩が、食事、栄養、および / または健康補助食品としての使用のため、マイトファジーおよび / またはオートファジーを増加させるため、ミトコンドリア機能を改善し、かつ / または細胞代謝を改善するため、筋肉機能および / または性能、身体の健康、フィットネス、筋肉 ATP^{max}、筋肉 ATP レベル、酸素消費、筋肉生体エネルギー、筋持久力、運動に対する耐性、運動からの回復、および / または持久力を維持および / または改善するため、不十分なミトコンドリア活性に関連する疾患、障害、または状態を治療または予防するため、あるいは加齢、虚弱、および / もしくは筋肉減少症中の筋肉機能の低下、筋肉関連の疾患、障害、もしくは状態、または老齢に関連する疾患、障害、もしくは状態を治療または予防するため、のものである、請求項 19 に記載の使用のための化合物。

【請求項 21】

前記カルニチンまたはその塩が、

(i) 1 日当たり 1 ~ 25 mmol の範囲の 1 日量で前記対象に経口投与される、

(ii) 100 mg ~ 500 mg の範囲の 1 日量で前記対象に経口投与される、

(iii) 500 mg ~ 1000 mg の範囲の 1 日量で前記対象に経口投与される、また

は

(i v) 5 0 0 m g ~ 2 0 0 0 m g の範囲の 1 日量で前記対象に経口投与される、
のいずれかである、請求項 1 9 または請求項 2 0 に記載の使用のための化合物。

【請求項 2 2】

前記式 (I) の化合物またはその塩が、ソフトゲルカプセルである剤形で投与される、
請求項 1 ~ 2 1 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 2 3】

前記式 (I) の化合物またはその塩が、

a) 中鎖トリグリセリドと、

b) 前記式 (I) の化合物またはその塩と、を含む組成物の形態で投与される、請求項 1
~ 2 2 のいずれかに記載の使用のための化合物。

【請求項 2 4】

前記式 (I) の化合物またはその塩が、乳化剤および / または安定剤を含む組成物の形
態で投与される、請求項 2 3 に記載の使用のための化合物。

【請求項 2 5】

前記式 (I) の化合物またはその塩が、2 0 ~ 6 0 % w / w の中鎖トリグリセリドを含
む組成物の形態で投与される、請求項 2 3 または請求項 2 4 に記載の使用のための化合物
。

【請求項 2 6】

前記式 (I) の化合物が、0 . 5 : 1 ~ 3 : 1 の範囲の比で中鎖トリグリセリド構成成
分と式 (I) の化合物とを含む組成物の形態で投与される、請求項 2 3 ~ 2 5 のいずれか
に記載の使用のための化合物。

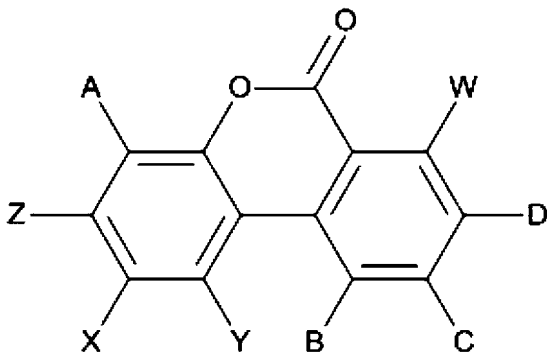
【請求項 2 7】

前記治療および / または予防が、ミトコンドリア発生を増加させることを含む、請求項
1 ~ 2 6 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 2 8】

ミトコンドリア発生の増加に使用するための式 (I) の化合物

【化 3】



(I)

(式中、A、B、C、D、W、X、Y、および Z がそれぞれ独立して、H および OH から
選択される)、

またはその塩であって、

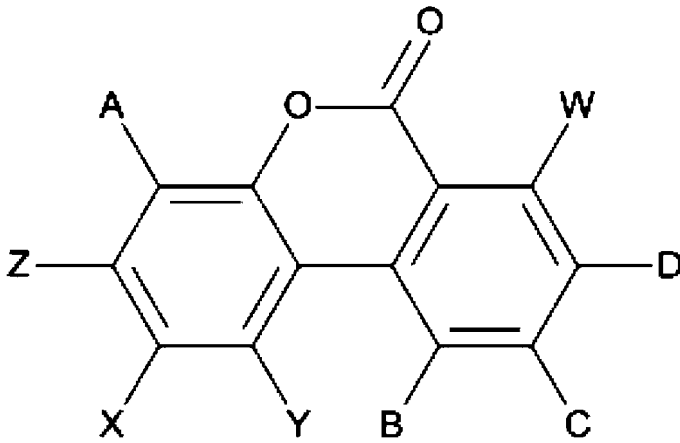
(i) 少なくとも 2 1 日間にわたって、1 日当たり 2 . 8 ~ 6 . 6 m m o l の 1 日量で、
(i i) 9 0 0 ~ 1 3 5 0 n g / m L の式 (1) の化合物および / もしくはその代謝産物
のピーク血漿レベルを達成するのに十分な用量、または
(i i i) 2 6 0 ~ 9 6 0 n g / m L の式 (1) の化合物および / もしくはその代謝産物
の定常状態血漿レベルを達成するのに十分な用量で、のいずれかで対象に経口投与される
、前記化合物、またはその塩。

【請求項 2 9】

対象におけるマイトファジーおよび / またはオートファジーを増加させ、ミトコンドリ

ア機能を改善し、および/または細胞代謝を改善する方法であって、前記方法が、式(I)の化合物

【化4】



(I)

(式中、A、B、C、D、W、X、Y、およびZがそれぞれ独立して、HおよびOHから選択される)、
またはその塩を、
少なくとも21日間にわたって、1日当たり2.8~6.6mmolの1日量で対象に経口投与することを含む、方法。