

【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28年9月29日(2016.9.29)

【公表番号】特表2015-519347(P2015-519347A)

【公表日】平成27年7月9日(2015.7.9)

【年通号数】公開・登録公報2015-044

【出願番号】特願2015-514191(P2015-514191)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/137	(2006.01)
C 1 2 Q	1/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 K	45/06	
A 6 1 K	31/137	
C 1 2 Q	1/02	Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成28年8月8日(2016.8.8)

【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】

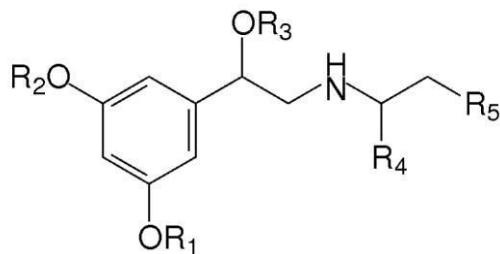
【特許請求の範囲】

【請求項1】

カンナビノイド(CB)受容体活性によって調節される障害又は疾患を治療するための医薬組成物であって、

式

【化1】

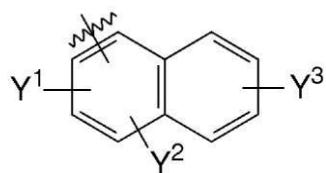


[式中、R<sub>1</sub>～R<sub>3</sub>は独立に、水素、アシル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル(カルバモイル)又はそれらの組合せであり、

R<sub>4</sub>は、H又は低級アルキルであり、

R<sub>5</sub>は、

## 【化2】



(式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>及びY<sup>3</sup>は独立に、水素、低級-O R<sub>6</sub>及び-N R<sub>7</sub> R<sub>8</sub>であり、R<sub>6</sub>は、H又は低級アルキルであり、R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は独立に、水素、低級アルキル、アルコキシカルボニル、アシル又はアミノカルボニルである)である]

を有する化合物を含有し、前記化合物は光学活性であり、前記化合物はC B受容体活性によって調節される障害又は疾患と関連している1種又は複数の徴候又は症状を低減する、上記医薬組成物。

## 【請求項2】

前記化合物内のR<sub>4</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル又はイソプロピル基である、請求項1に記載の医薬組成物。

## 【請求項3】

前記化合物内のR<sub>4</sub>が、メチル基である、請求項2に記載の医薬組成物。

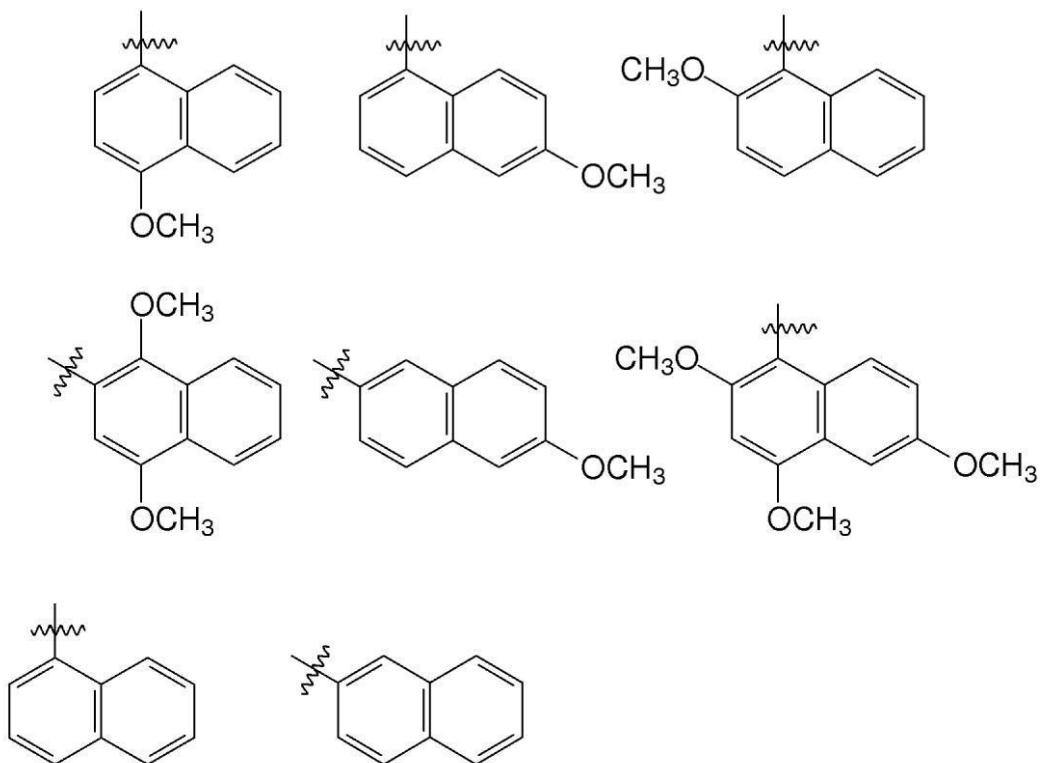
## 【請求項4】

前記化合物内のR<sub>6</sub>が、メチル基である、請求項1から3までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項5】

前記化合物内のR<sub>5</sub>が、以下の構造：

## 【化3】



のうち 1 種である、請求項 1 から 3 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記化合物内の R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub> 及び R<sub>3</sub> が、水素である、請求項 1 から 5 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

(R, R') - 4' - メトキシ - 1 - ナフチルフェノテロール (MNF)、(R, S') - MNF、(R, R') - エチルMNF、(R, R') - ナフチルフェノテロール (NF)、(R, R') - エチルNF、(R, S') - NF 及び (R, R') - 4' - アミノ - 1 - ナフチルフェノテロール (アミノNF)、(R, R') - 4' - ヒドロキシ - 1 - ナフチルフェノテロール (ヒドロキシNF) 又はそれらの組合せ含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

MNF、NF 又はそれらの組合せを含有する、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

MNF を含有する、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

対象が CB 受容体活性によって調節される障害若しくは疾患を有するか、又はそれを発症する危険性がある、請求項 1 から 9 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の医薬組成物であって、前記医薬組成物を投与する前に、対象から得られたサンプルにおいて、CB 受容体活性又は発現（又は両方）が測定され、CB 受容体活性又は発現（又は両方）の存在が、対象が、CB 受容体活性によって調節される障害若しくは疾患を有するか、又はそれを発症する危険性があることを示す、医薬組成物。

【請求項 12】

対象が 2 - AR 活性を標的とする治療に応答しない障害又は疾患を有する、請求項 10 又は 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

CB 受容体を発現する腫瘍の治療において使用される、請求項 1 から 12 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

対象の障害又は疾患が、CB 受容体を発現する原発性脳腫瘍、CB 受容体を発現する星状細胞腫、CB 受容体を発現する膠芽腫、CB 受容体を発現する肝細胞癌腫、結腸癌、肝臓癌、肺癌、乳癌、及び膵臓癌からなる群から選択される、請求項 1 から 12 までに記載の医薬組成物。

【請求項 15】

疾患又は障害と関連している 1 種又は複数の徴候又は症状を低減することが、腫瘍若しくは癌細胞成長（又は両方）などの細胞成長、腫瘍体積又はそれらの組合せを低減することを含む、請求項 1 から 14 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記 CB 受容体が、GPR55 である、請求項 1 から 15 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記化合物の投与の前に、それと一緒に、又はその後などに、さらなる治療薬が投与される、請求項 1 から 16 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記さらなる治療薬が化学療法薬である、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記化合物が医薬上許容される担体とともに投与される、請求項 1 から 18 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

前記対象がヒトである、請求項 1 から 19 までのいずれか一項に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0322

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0322】

開示されている本発明の原則が適用され得る多数の可能性ある実施形態を考慮して、例示された実施形態は、単に本発明の好ましい実施例であって、本発明の範囲を制限するところではないということは認識されなければならない。そうではなく、本発明の範囲は、以下の特許請求の範囲によって規定される。したがって、本発明者らは、本発明者らの発明として、これらの特許請求の範囲及び趣旨内に入るすべてを特許請求する。

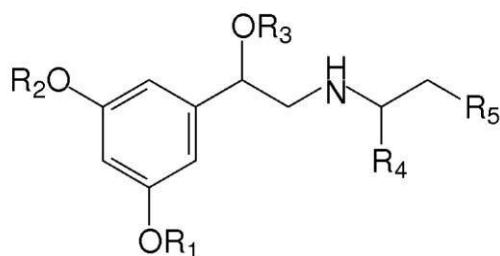
我々は以下を特許請求する。

【請求項 1】

カンナビノイド(CB)受容体活性によって調節される障害又は疾患を治療する方法であって、

C B受容体活性によって調節される障害若しくは疾患を有するか、又はそれを発症する危険性がある対象に、C B受容体活性によって調節される障害又は疾患と関連している1種又は複数の症状を低減するのに有効な量の化合物を投与し、それによって、C B受容体活性によって調節される対象における障害又は疾患と関連している1種又は複数の症状を低減することを含み、前記化合物は、式

【化1】

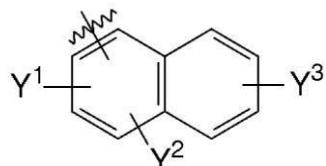


[式中、R<sub>1</sub>～R<sub>3</sub>は独立に、水素、アシル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル(カルバモイル)又はそれらの組合せであり、

R<sub>4</sub>は、H又は低級アルキルであり、

R<sub>5</sub>は、

【化2】



(式中、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>及びY<sup>3</sup>は独立に、水素、低級-O-R<sub>6</sub>及び-NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>であり、

R<sub>6</sub>は、H又は低級アルキルであり、

R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は独立に、水素、低級アルキル、アルコキシカルボニル、アシル又はアミノカルボニルである)である]

を有し、前記化合物は光学活性である、上記方法。

## [請求項 2]

投与することが、治療上有効な量の化合物を投与することを含み、前記化合物内のR<sub>4</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル又はイソプロピル基である、請求項1に記載の方法。

## [請求項 3]

投与することが、治療上有効な量の化合物を投与することを含み、前記化合物内のR<sub>4</sub>が、メチル基である、請求項2に記載の方法。

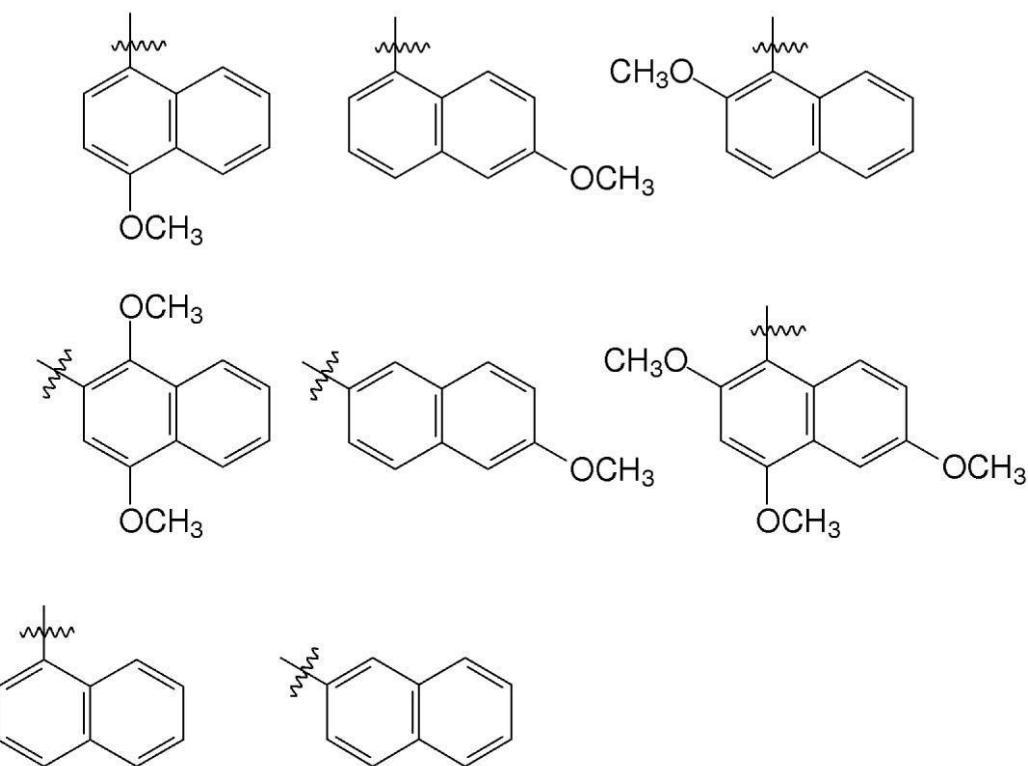
## [請求項 4]

投与することが、治療上有効な量の化合物を投与することを含み、前記化合物内のR<sub>6</sub>が、メチル基である、請求項1から3までのいずれか一項に記載の方法。

## [請求項 5]

投与することが、治療上有効な量の化合物を投与することを含み、前記化合物内のR<sub>5</sub>が、以下の構造：

## [化3]



のうち1種である、請求項1から3までのいずれか一項に記載の方法。

## [請求項 6]

投与することが、治療上有効な量の化合物を投与することを含み、前記化合物内のR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>が、水素である、請求項1から5までのいずれか一項に記載の方法。

## [請求項 7]

投与することが、治療上有効な量の(R, R')-4'-メトキシ-1-ナフチルフェノテロール(MNF)、(R, S')-MNF、(R, R')-エチルMNF、(R, R')-ナフチルフェノテロール(NF)、(R, R')-エチルNF、(R, S')-NF及び(R, R')-4'-アミノ-1-ナフチルフェノテロール(アミノNF)、(R, R')-4'-ヒドロキシ-1-ナフチルフェノテロール(ヒドロキシNF)又はこれらの組合せを投与することを含む、請求項1に記載の方法。

## [請求項 8]

投与することが、治療上有効な量のMNF、NF又はこれらの組合せを投与することを含む、請求項7に記載の方法。

[ 請求項 9 ]

投与することが、治療上有効な量のM N Fを投与することを含む、請求項7に記載の方法。

[ 請求項 10 ]

治療上有効な量の化合物を投与する前に、C B受容体活性によって調節される障害若しくは疾患を有するか、又はそれを発症する危険性がある対象を選択することをさらに含む、請求項1から9までのいずれか一項に記載の方法。

[ 請求項 11 ]

C B受容体活性によって調節される障害若しくは疾患を有するか、又はそれを発症する危険性がある対象を選択することが、対象から得られたサンプルにおいて、C B受容体活性又は発現（又は両方）を測定することを含み、C B受容体活性又は発現（又は両方）の存在が、対象が、C B受容体活性によって調節される障害若しくは疾患を有するか、又はそれを発症する危険性があることを示す、請求項10に記載の方法。

[ 請求項 12 ]

C B活性によって調節される障害若しくは疾患を有するか、又はそれを発症する危険性がある対象を選択することが、治療上有効な量の化合物を投与する前に、2 - A R活性を標的とする治療に応答しない障害又は疾患を有する対象を選択することを含む、請求項10又は11に記載の方法。

[ 請求項 13 ]

C B受容体を発現する腫瘍の治療において使用される、請求項1から12までのいずれか一項に記載の方法。

[ 請求項 14 ]

障害又は疾患が、C B受容体を発現する原発性脳腫瘍、C B受容体を発現する星状細胞腫、C B受容体を発現する膠芽腫、C B受容体を発現する肝細胞癌腫、結腸癌、肝臓癌及び肺癌からなる群から選択される、請求項1から12までに記載の方法。

[ 請求項 15 ]

疾患又は障害と関連している1種又は複数の徵候又は症状を阻害することが、腫瘍若しくは癌細胞成長（又は両方）などの細胞成長、腫瘍体積又はそれらの組合せを阻害することを含む、請求項1から14までのいずれか一項に記載の方法。

[ 請求項 16 ]

前記C B受容体が、G P R 5 5である、請求項1から15までのいずれか一項に記載の方法。

[ 請求項 17 ]

化合物の投与の前に、それと一緒に、又はその後などに、さらなる治療薬を投与することをさらに含む、請求項1から16までのいずれか一項に記載の方法。

[ 請求項 18 ]

前記さらなる治療薬が化学療法薬である、請求項17に記載の方法。

[ 請求項 19 ]

治療上有効な量の化合物を投与することが、治療上有効な量の前記化合物を医薬上許容される担体とともに投与することを含む、請求項1から18までのいずれか一項に記載の方法。

[ 請求項 20 ]

前記対象がヒトである、請求項1から19までのいずれか一項に記載の方法。