

【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17年10月27日(2005.10.27)

【公開番号】特開2003-155229(P2003-155229A)

【公開日】平成15年5月27日(2003.5.27)

【出願番号】特願2002-260534(P2002-260534)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/133

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 43/00

【F I】

A 6 1 K 31/133

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成17年8月25日(2005.8.25)

【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

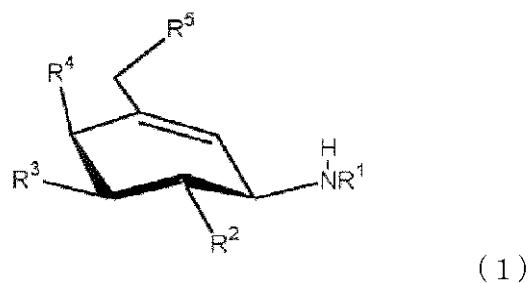
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】下記一般式(1)で表されるカルバ糖アミン誘導体を有効成分とする糖脂質代謝異常症処置剤。

【化1】



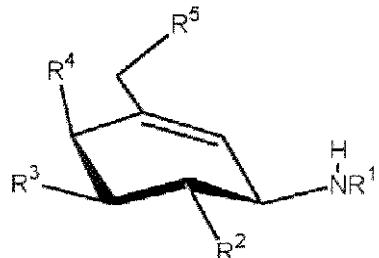
但し、R<sup>1</sup>はアルキル基を示し、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>はそれぞれ独立にヒドロキシル基又は置換基を有するヒドロキシル基である。

【請求項2】R<sup>1</sup>は炭素数1~23の直鎖又は分枝を有するアルキル基であり、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>がそれぞれヒドロキシル基である請求項1記載の糖脂質代謝異常症処置剤。

【請求項3】経口投与用製剤であることを特徴とする請求項1又は2記載の糖脂質代謝異常症処置剤。

【請求項4】下記一般式(1)で表されるカルバ糖アミン誘導体を有効成分とするガラクトシダーゼ活性増強剤。

【化2】



(1)

但し、R<sup>1</sup>はアルキル基を示し、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>はそれぞれ独立にヒドロキシル基又は置換基を有するヒドロキシル基である。

**【手続補正2】**

**【補正対象書類名】**明細書

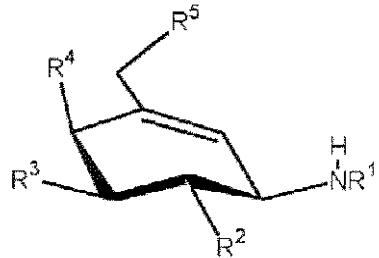
**【補正対象項目名】**0006

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

**【0006】**

**【化3】**



(1)

**【手続補正3】**

**【補正対象書類名】**明細書

**【補正対象項目名】**0012

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

**【0012】**

尚、本発明薬剤の有効成分であるカルバ糖アミン誘導体は擬似糖の1種であるため、本明細書中における炭素番号の付与は、ヘキソースの例に従って下記構造式(2)に示す方法によって記載する。

**【手続補正4】**

**【補正対象書類名】**明細書

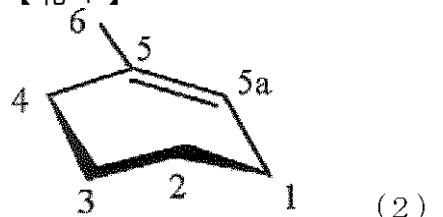
**【補正対象項目名】**0013

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

**【0013】**

**【化4】**



(2)

**【手続補正5】**

**【補正対象書類名】**明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

また、一般式(1)は5a-カルバ-D-ヘキソピラノースの(5-5a)不飽和誘導体と見なせるため、1位に結合した置換アミノ基( $\text{NHR}_1$ )が六員環に対して上側にあるものをI型、反対側にあるものをII型とするとき、本発明薬剤の有効成分であるカルバ糖アミン誘導体はI型である。本発明薬剤の有効成分であるカルバ糖アミン誘導体は、下記一般式(3)に示す物質が本発明薬剤の最も好ましい有効成分である。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

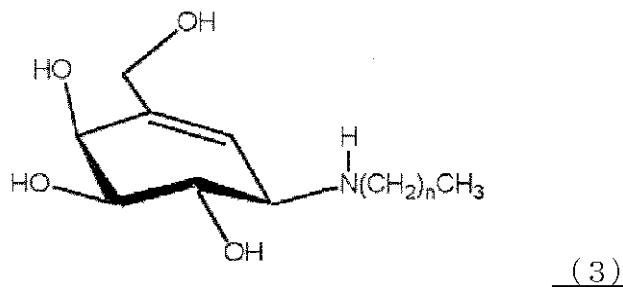
【補正対象項目名】0015

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0015】

【化5】



【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0018】

尚、本発明薬剤の有効成分であるカルバ糖アミン誘導体が有する $\alpha$ -ガラクトシダーゼ阻害活性は、 $\alpha$ -ガラクトシダーゼと基質が存在する溶液中に、被検物質を添加し、酵素活性を本発明物質無添加の場合と比較することで、算出することが可能である。

【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0020

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0020】

【実施例】以下、本発明を実施例により具体的に説明する。カルバ糖アミン誘導体( $\text{R}_1=(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$ :N-オクチル-5a-カルバ- $\beta$ -L-arabino-ヘキソ-5(5a)-エノピラノシリルアミン)の合成

【手続補正9】

【補正対象書類名】明細書

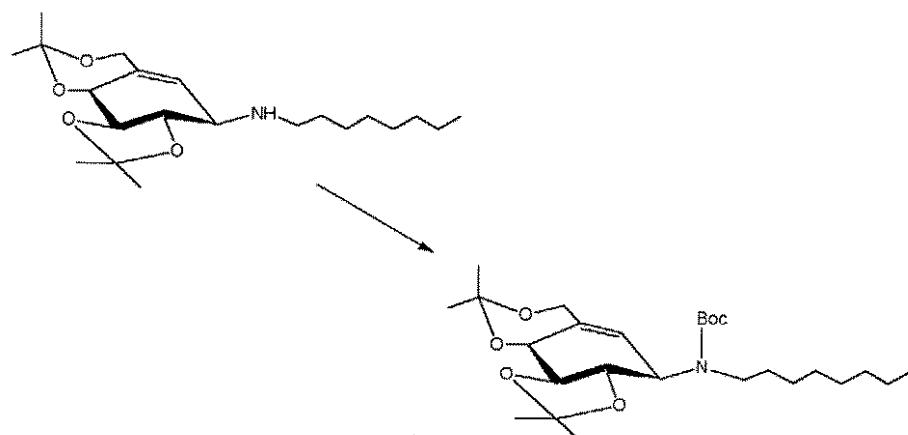
【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0022】

## 【化 6】



化合物 1

## 【手続補正 1 0】

【補正対象書類名】明細書

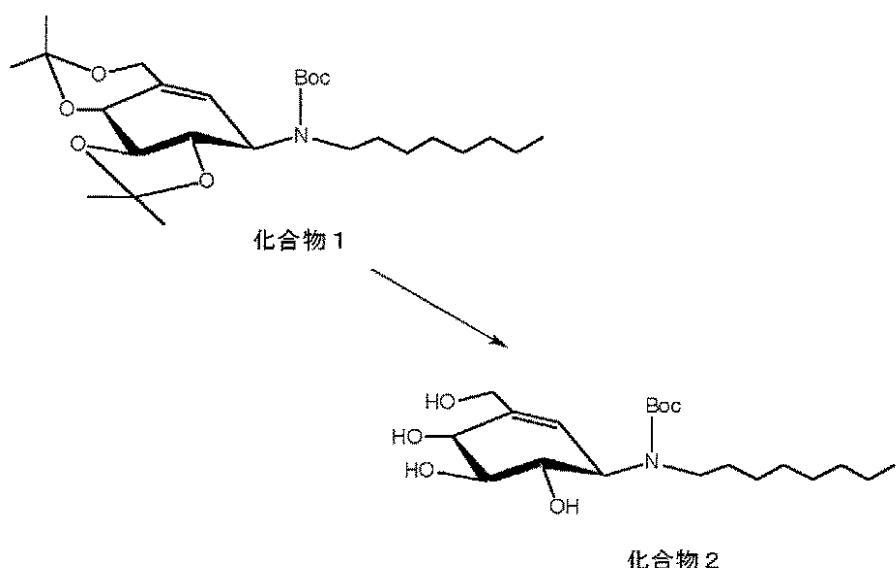
【補正対象項目名】0 0 2 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 8】

## 【化 7】



化合物 2

## 【手続補正 1 1】

【補正対象書類名】明細書

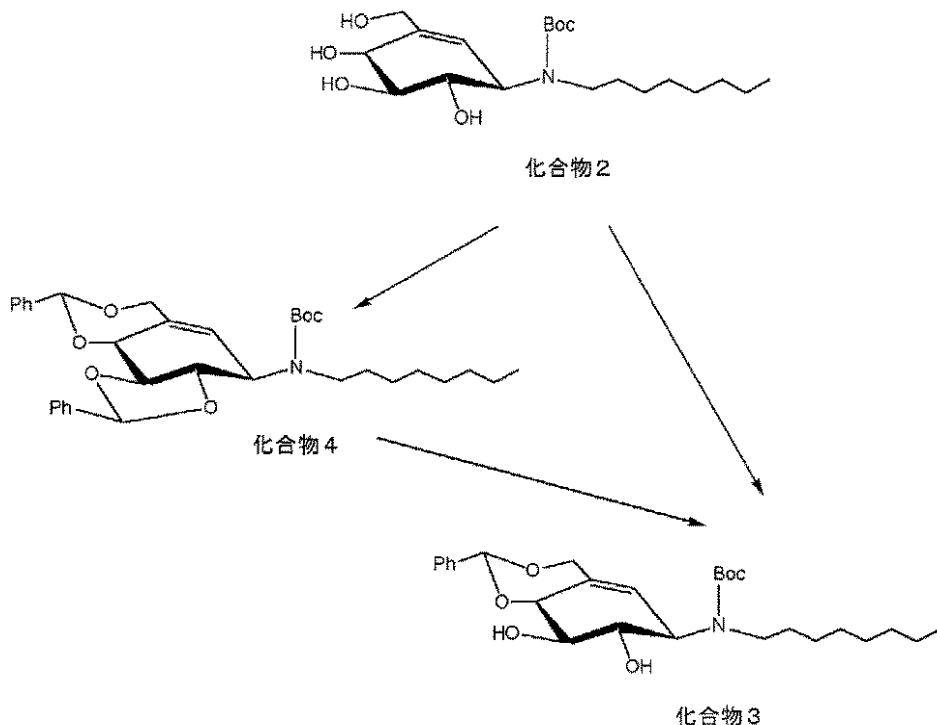
【補正対象項目名】0 0 3 2

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 2】

【化 8】



【手続補正 1 2】

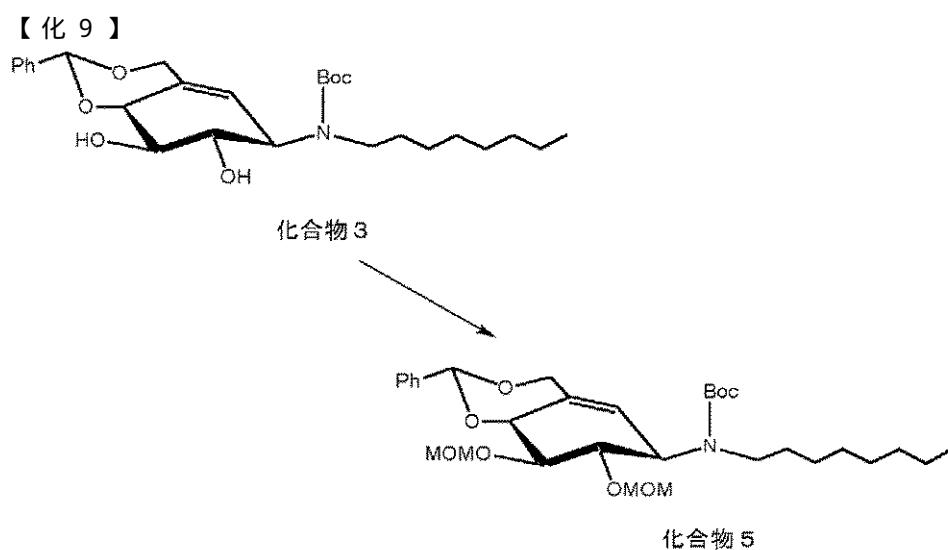
【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 3 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 8】



【手続補正 1 3】

【補正対象書類名】明細書

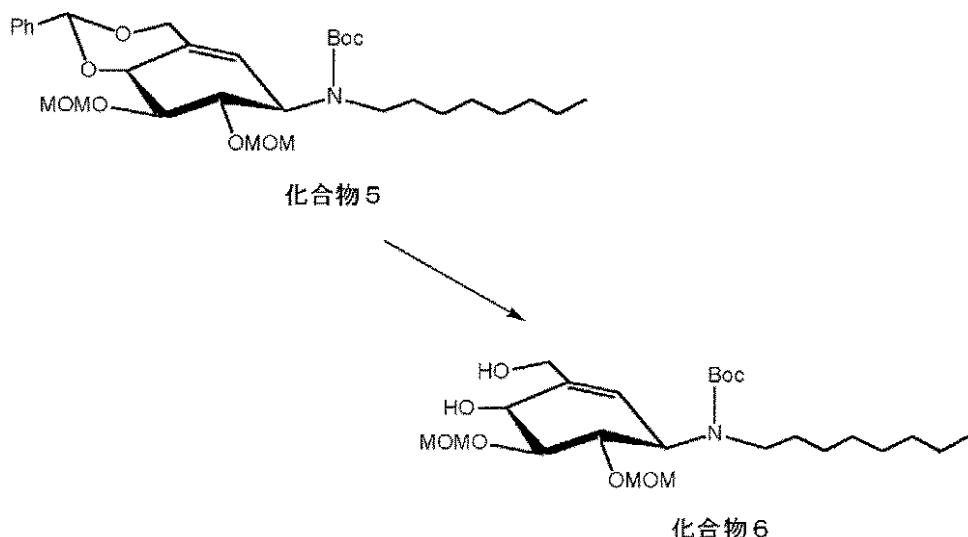
【補正対象項目名】0 0 4 2

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 4 2】

## 【化 1 0】



## 【手続補正 1 4】

【補正対象書類名】明細書

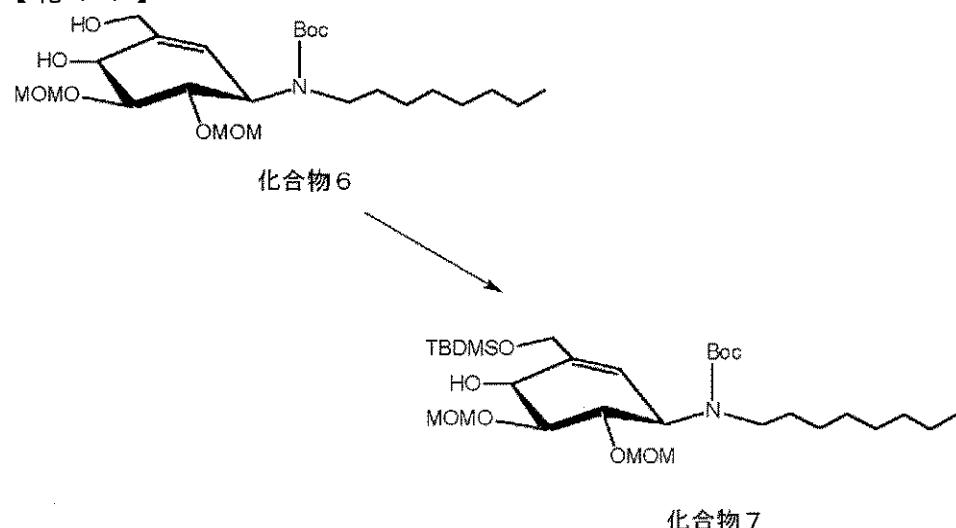
【補正対象項目名】0 0 4 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 4 6】

## 【化 1 1】



## 【手続補正 1 5】

【補正対象書類名】明細書

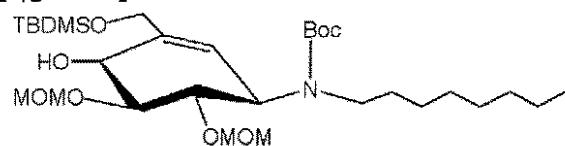
【補正対象項目名】0 0 5 0

【補正方法】変更

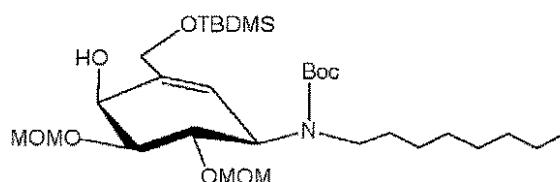
【補正の内容】

【0 0 5 0】

## 【化12】



化合物7



化合物8

## 【手続補正16】

【補正対象書類名】明細書

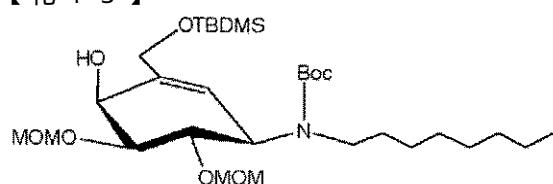
【補正対象項目名】0054

【補正方法】変更

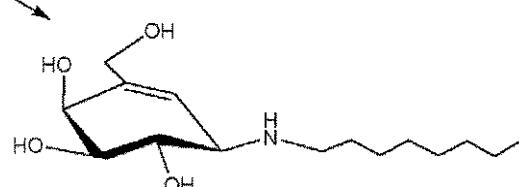
【補正の内容】

【0054】

## 【化13】



化合物8



(1)