

【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

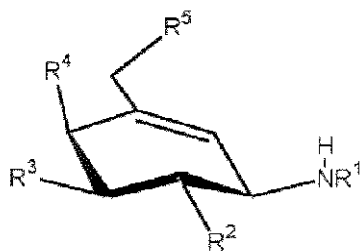
【補正方法】変更

【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】



(1)

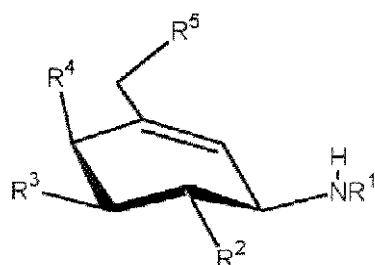
但し、 R^1 はアルキル基を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 はそれぞれ独立にヒドロキシル基又は置換基を有するヒドロキシル基である。

【請求項 2】 R^1 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^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 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^1 はアルキル基を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 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

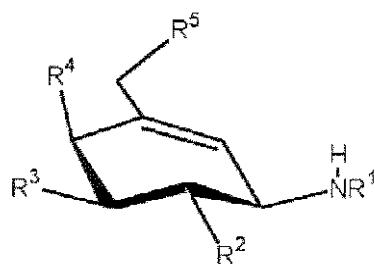
【補正対象項目名】0006

【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

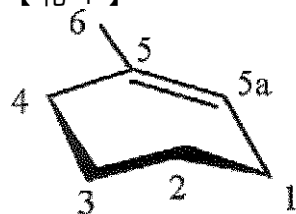
【補正対象項目名】0013

【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】 0 0 1 4

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 1 4 】

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 (NHR_1) が六員環に対して上側にあるものを 型、反対側にあるものを 型とすると、本発明薬剤の有効成分であるカルバ糖アミン誘導体は 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

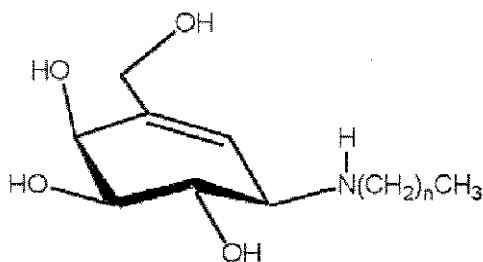
【補正対象項目名】 0 0 1 5

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 1 5 】

【化 5】



(3)

【手続補正 7】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 0 0 1 8

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 1 8 】

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 -ガラクトシダーゼ阻害活性は、 -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】 0 0 2 0

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 2 0 】

【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- -L-arabino-ヘキソ-5(5a)-エノピラノシルアミン) の合成

【手続補正 9】

【補正対象書類名】 明細書

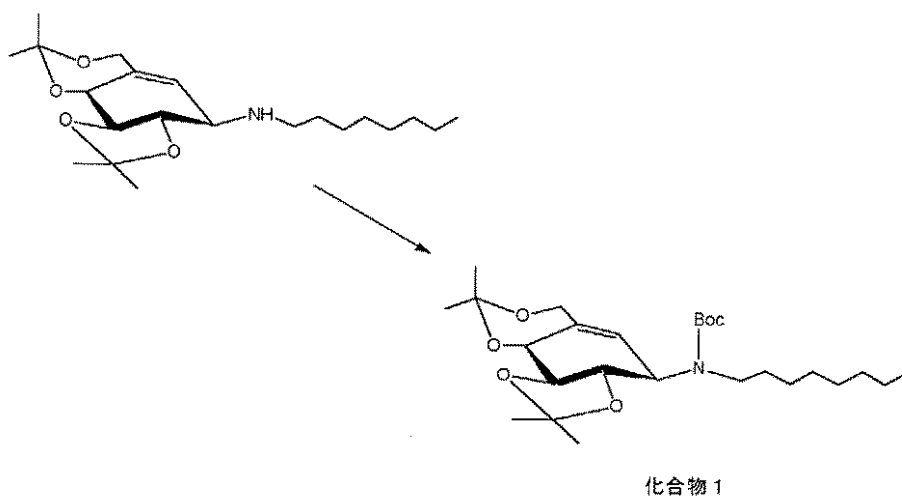
【補正対象項目名】 0 0 2 2

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 2 2 】

【化 6】



【手続補正 10】

【補正対象書類名】明細書

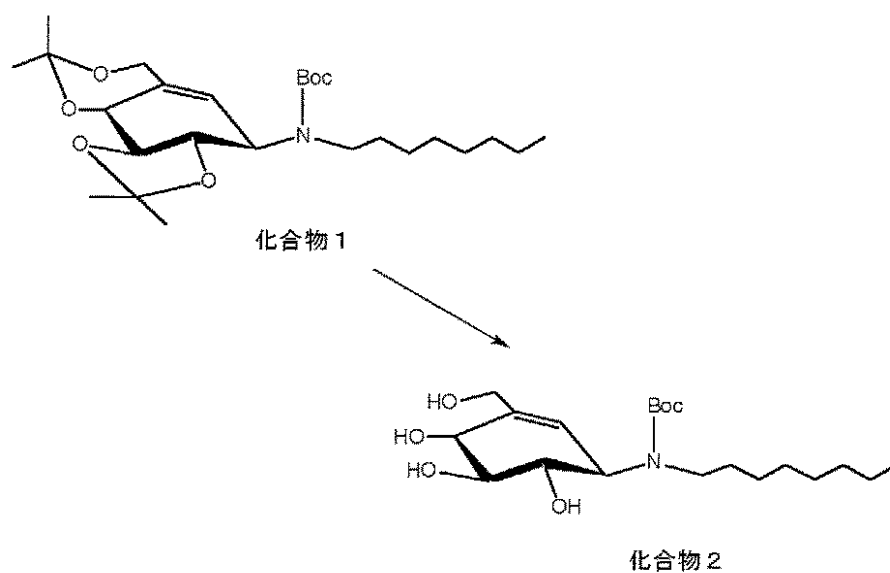
【補正対象項目名】0028

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0028】

【化 7】



【手続補正 11】

【補正対象書類名】明細書

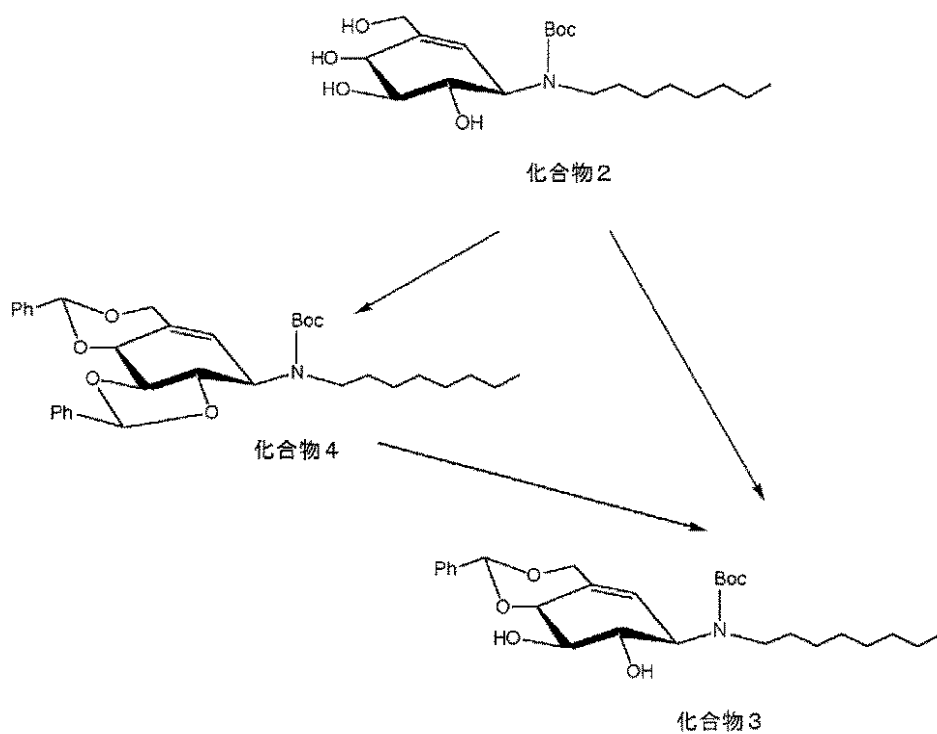
【補正対象項目名】0032

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0032】

【化 8】



【手続補正 1 2】

【補正対象書類名】明細書

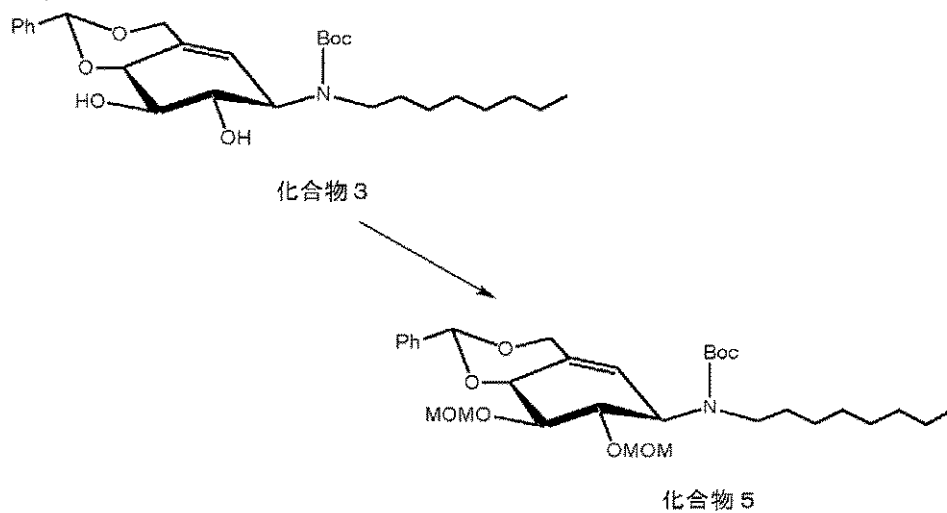
【補正対象項目名】0 0 3 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 8】

【化 9】



【手続補正 1 3】

【補正対象書類名】明細書

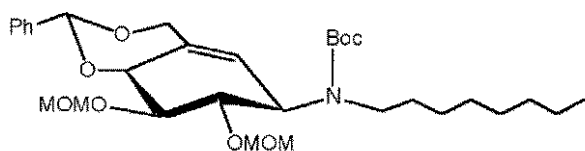
【補正対象項目名】0 0 4 2

【補正方法】変更

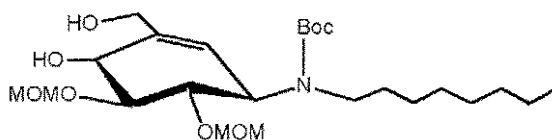
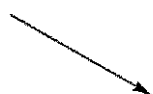
【補正の内容】

【0 0 4 2】

【化 1 0】



化合物 5



化合物 6

【手続補正 1 4】

【補正対象書類名】明細書

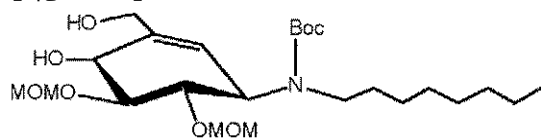
【補正対象項目名】0 0 4 6

【補正方法】変更

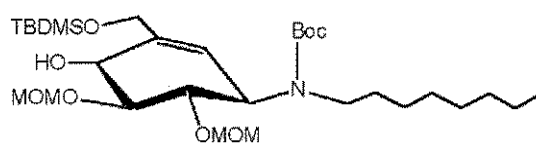
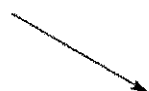
【補正の内容】

【0 0 4 6】

【化 1 1】



化合物 6



化合物 7

【手続補正 1 5】

【補正対象書類名】明細書

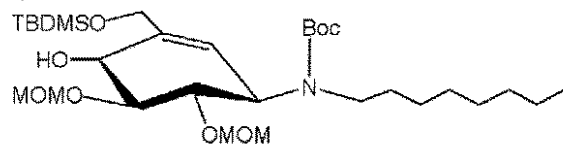
【補正対象項目名】0 0 5 0

【補正方法】変更

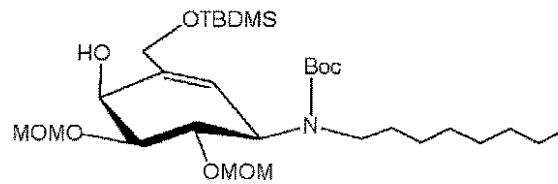
【補正の内容】

【0 0 5 0】

【化 1 2】



化合物 7



化合物 8

【手続補正 1 6】

【補正対象書類名】明細書

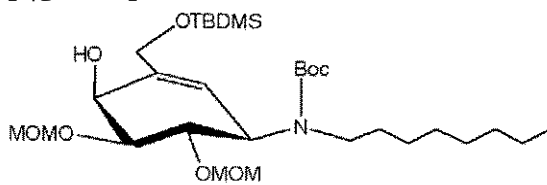
【補正対象項目名】0 0 5 4

【補正方法】変更

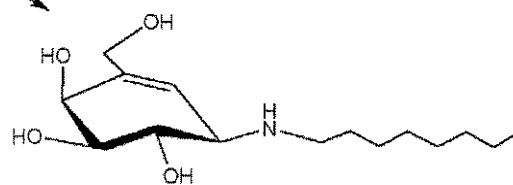
【補正の内容】

【0 0 5 4】

【化 1 3】



化合物 8



(1)