

【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 1 部門第 1 区分

【発行日】平成28年1月21日 (2016.1.21)

【公表番号】特表2015-500639(P2015-500639A)

【公表日】平成27年1月8日 (2015.1.8)

【年通号数】公開・登録公報2015-002

【出願番号】特願2014-544878(P2014-544878)

【国際特許分類】

C 1 2 P 7/64 (2006.01)

A 6 1 K 31/202 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

【F I】

C 1 2 P 7/64

A 6 1 K 31/202

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 11/00

【手続補正書】

【提出日】平成27年11月27日 (2015.11.27)

【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】

18 - 炭素脂肪酸を含む植物種子油から 20 - 炭素脂肪酸を製造する方法であって、2 個の炭素原子により、植物種子油中に存在する 18 - 炭素脂肪酸の少なくとも一部を伸長させて、20 - 炭素脂肪酸を製造することを含む、方法。

【請求項 2】

前記伸長工程が 18 - 炭素脂肪酸を酵素と接触させることを含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

酵素がエロンガーゼを含む、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

20 - 炭素脂肪酸の少なくとも一部をエステル化する工程をさらに含む、請求項 3 に記載の方法。

【請求項 5】

18 - 炭素脂肪酸が、複数の異なる 18 - 炭素脂肪酸を含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

18 - 炭素脂肪酸が、ステアリドン酸（「SDA」）、 γ -リノレン酸（「GLA」）および リノレン酸（「ALA」）のうち1以上を含み、20 - 炭素脂肪酸が、エイコサテトラエン酸（「ETA」）、エイコサトリエン酸（「ETE」）およびジホモ- γ -リノレン酸（「DGLA」）のうち1以上を含む、請求項1～5のいずれか1項に記載の方法。

【請求項7】

伸長工程前に植物種子油から18 - 炭素脂肪酸を抽出する工程をさらに含む、請求項1に記載の方法。

【請求項8】

18 - 炭素脂肪酸が、有機溶媒抽出または超臨界流体抽出によって植物種子油から抽出される、請求項7に記載の方法。

【請求項9】

超臨界流体抽出がCO₂超臨界流体抽出（CO₂-SFE）を含む、請求項8に記載の方法。

【請求項10】

場合によっては尿素分画化、低温結晶化、クロマトグラフィー分離、HPLCまたは蒸留によって20 - 炭素脂肪酸を精製することをさらに含む、請求項1～9のいずれか1項に記載の方法。

【請求項11】

20 - 炭素脂肪酸を精製して、少なくとも30重量%、少なくとも40重量%、少なくとも50重量%、少なくとも60重量%、少なくとも70重量%、少なくとも80重量%、少なくとも90重量%または90重量%を超える純度を有する20 - 炭素脂肪酸を製造する、請求項10に記載の方法。

【請求項12】

植物種子油が、エキウム種子油、クロフサスグリ種子油、ルリジサ種子油、マツヨイグサ種子油、ハッケリア（hackelia）種子油、トリコデスマ（trichodesma）種子油、ブグロソイデス（Buglossoides）種子油およびそれらの組み合わせを含む群から選択される、請求項1に記載の方法。

【請求項13】

場合によっては20 - 炭素脂肪酸をシリカおよびチャコールの混合物と混合することによって、またはセライトフィルターに20 - 炭素脂肪酸を通過させることによって、20 - 炭素脂肪酸を脱臭することをさらに含む、請求項1～12のいずれか1項に記載の方法。

【請求項14】

場合によっては、DGLAをアルコールおよび酸と接触させ、DGLA、ETEおよび/またはETAエステルを製造することによって、DGLA、ETEおよび/またはETAをエステル化することをさらに含み、該エステルがアルキルエステル、ヘテロアルキルエステル、アリールエステル、ヘテロアリールエステル、メチルエステル、エチルエステル、プロピルエステル、イソプロピルエステル、ブチルエステル、イソブチルエステル、*t*-ブチルエステルおよびそれらの組み合わせからなる群から場合によっては選択される、請求項6に記載の方法。

【請求項15】

製造される20 - 炭素脂肪酸と植物種子油中の18 - 炭素脂肪酸とのモル比が約1：1である、請求項1に記載の方法。

【請求項16】

製造される20 - 炭素脂肪酸が、植物種子油中の18 - 炭素脂肪酸のモル比よりも大きい、20 - 炭素オメガ - 6脂肪酸と20 - 炭素オメガ - 3脂肪酸とのモル比を有し、前記18 - 炭素脂肪酸のモル比が18 - 炭素オメガ - 6脂肪酸と18 - 炭素オメガ - 3脂肪酸とのモル比により定義される、請求項1に記載の方法。

【請求項17】

請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の方法によって製造される 20 - 炭素脂肪酸を含む組成物。

【請求項 18】

少なくとも 30 重量%、少なくとも 40 重量%、少なくとも 50 重量%、少なくとも 60 重量%、少なくとも 70 重量%、少なくとも 80 重量%、少なくとも 90 重量%または 90 重量%を超える、DGLA、ETA および ETE の 1 以上を含む、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 19】

植物種子油から 18 - 炭素脂肪酸を抽出し、2 個の炭素原子によって脂肪酸を伸長させることを含む、植物種子油中の脂肪酸を伸長させるための方法。

【請求項 20】

植物種子油中の 2 以上の 18 - 炭素脂肪酸が同時に伸長させられる、請求項 2 または 19 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 21】

ジホモ - リノレン酸 (「DGLA」)、エイコサトリエン酸 (「ETE」) およびエイコサテトラエン酸 (「ETA」) を含む組成物を製造する方法であって、ステアリン酸 (「SDA」)、リノレン酸 (「ALA」) および - リノレン酸 (「GLA」) を含む植物種子油中の SDA、ALA および GLA を濃厚化し; 2 個の炭素原子によって SDA、ALA および GLA をそれぞれ同時に伸長させ、DGLA、ETE および ETA を提供することを含む、前記方法。

【請求項 22】

DGLA、ETE および ETA を含む組成物を濃厚化することをさらに含む、請求項 21 に記載の方法。

【請求項 23】

少なくとも 50 重量%の DGLA、ETE および / または ETA を含む、請求項 21 に記載の方法によって製造される組成物。

【請求項 24】

約 1 : 10 ~ 約 10 : 1 の DGLA : ETE + ETA のモル比を含む、請求項 21 に記載の方法によって製造される組成物。

【請求項 25】

植物種子油中の SDA、ALA および GLA を濃厚化する工程が、(i) アセトン、水およびヘプタンからなる溶媒系と植物種子油を接触させ、(ii) 得られた混合物を結晶形成を誘導するのに十分な温度まで冷却し、(iii) 植物種子油 - 溶媒系混合物から結晶を分離して、SDA、ALA および GLA が濃厚化された植物種子油を製造することを含む、請求項 21 に記載の方法。

【請求項 26】

2 個の炭素原子によって SDA、ALA および GLA をそれぞれ同時に伸長させる工程が、

(i) SDA、ALA および GLA をエステル化して、SDA、ALA および GLA エステルを形成すること;

(ii) SDA、ALA および GLA エステルを還元して、SDA、ALA および GLA 一級アルコールを形成すること;

(iii) SDA、ALA および GLA 一級アルコールをメシル化して、SDA、ALA および GLA メシル化物を形成すること;

(iv) 脱プロトン化マロン酸ジエステルである C_2 - 伸長ブロックと SDA、ALA および GLA メシル化物とを接触させて、伸長 SDA、ALA および GLA ジエステルを形成すること;

(v) 伸長 SDA、ALA および GLA ジエステルを加水分解して、伸長 SDA、ALA および GLA 二酸を形成すること; ならびに

(vi) 伸長 SDA、ALA および GLA 二酸を脱炭酸化して、DGLA、ETE お

よび E T A を形成すること

を含む、請求項 2 1 に記載の方法。

【請求項 2 7】

D G L A、E T E および E T A を濃厚化する工程が、(i) D G L A、E T E および E T A を含む組成物とヘプタンを含む溶媒系とを接触させ、(i i) 得られた混合物を結晶形成を誘導するのに十分な温度まで冷却し、(i i i) 組成物 - 溶媒系混合物から結晶を分離して、D G L A、E T E および E T A を含む濃厚化組成物を製造することを含む、請求項 2 2 に記載の方法。

【請求項 2 8】

植物種子油から 2 0 - 炭素脂肪酸を製造する方法であって、

(a) リパーゼに植物種子油を曝露することによって、該植物種子油中の 1 8 - 炭素脂肪酸トリグリセリドのグリセロールバックボーンを消化し、1 8 - 炭素脂肪酸を含む油を形成する工程であって、該 1 8 - 炭素脂肪酸が遊離脂肪酸の形態である、前記工程、

(b) 場合によっては油から 1 8 - 炭素遊離脂肪酸の 1 以上を濃縮すること、

(c) 油、または場合によって濃縮した 1 8 - 炭素遊離脂肪酸をエロンガーゼで処理して、2 0 - 炭素脂肪酸を製造すること、ならびに

(d) 2 0 - 炭素脂肪酸の少なくとも一部をエステル化すること、ならびに

(e) 場合によってはエステル化 2 0 - 炭素脂肪酸の少なくとも一部を濃縮すること

、

を含む、前記方法。

【請求項 2 9】

約 1 : 1 0 ~ 約 1 0 : 1 のジホモ - リノレン酸 (「D G L A」) とエイコサトリエン酸 (「E T E」) + エイコサテトラエン酸 (「E T A」) とのモル比を有する、D G L A、E T E および E T A を含む医薬組成物。

【請求項 3 0】

D G L A、E T E および E T A がまとめて、組成物中に存在する全脂肪酸の少なくとも 7 0 重量 %、8 0 重量 % または 9 0 重量 % を構成する、請求項 2 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 1】

炎症、心血管系、呼吸器、神経性、癌、精神性または皮膚疾患の処置を必要とする対象における、炎症、心血管系、呼吸器、神経性、癌、精神性または皮膚疾患を処置するための医薬の製造における、ジホモ - リノレン酸 (「D G L A」)、エイコサトリエン酸 (「E T E」) およびエイコサテトラエン酸 (「E T A」) の使用であって、D G L A が E T E および E T A に対して、約 1 : 1 0 ~ 約 1 0 : 1 のモル比で存在する、前記使用。

【請求項 3 2】

D G L A、E T E および E T A がまとめて、医薬中に存在する全脂肪酸の少なくとも 7 0 重量 %、8 0 重量 % または 9 0 重量 % を構成する、請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 3】

炎症、心血管系、呼吸器、神経性、癌、精神性または皮膚疾患の処置を必要とする対象における、炎症、心血管系、呼吸器、神経性、癌、精神性または皮膚疾患を処置するためのジホモ - リノレン酸 (「D G L A」) であって、医薬がさらに E T E および E T A を含み、D G L A が E T E および E T A に対して、約 1 : 1 0 ~ 約 1 0 : 1 のモル比で存在する、前記 D G L A。

【請求項 3 4】

D G L A、E T E および E T A がまとめて、医薬中に存在する全脂肪酸の少なくとも 7 0 重量 %、8 0 重量 % または 9 0 重量 % を構成する、請求項 3 3 に記載の D G L A。