

【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30年6月7日(2018.6.7)

【公表番号】特表2017-519775(P2017-519775A)

【公表日】平成29年7月20日(2017.7.20)

【年通号数】公開・登録公報2017-027

【出願番号】特願2016-574402(P2016-574402)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|--------|-----------|
| A 6 1 K | 31/575 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/14 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/16 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/28 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/08 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/24 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/04 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 45/00 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/08 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/20 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/48 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 35/60 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|---------|--------|
| A 6 1 K | 31/575 |
| A 6 1 P | 1/10 |
| A 6 1 P | 1/12 |
| A 6 1 P | 1/04 |
| A 6 1 P | 3/10 |
| A 6 1 P | 25/14 |
| A 6 1 P | 25/16 |
| A 6 1 P | 25/00 |
| A 6 1 P | 25/28 |
| A 6 1 P | 25/08 |
| A 6 1 P | 25/24 |
| A 6 1 P | 35/00 |
| A 6 1 P | 35/04 |
| A 6 1 K | 45/00 |
| A 6 1 K | 9/08 |
| A 6 1 K | 9/20 |
| A 6 1 K | 9/48 |
| A 6 1 K | 35/60 |

【手続補正書】

【提出日】平成30年4月12日(2018.4.12)

【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】

アミノステロール誘導GI応答の刺激から利益を得る病状又は障害の処置又は予防における使用のための、薬学的に許容される等級の少なくとも1つのアミノステロール又はその薬学的に許容される塩若しくは誘導体を含む組成物であって、

前記使用が、組成物の経口投与を含み、

少なくとも1つのアミノステロール又はその薬学的に許容される塩若しくは誘導体が、組成物中に、有益な効果を生ずるために十分な量で存在している、組成物。

【請求項2】

病状が、胃腸運動の障害である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

障害又は病状が、慢性特発性便秘、過敏性腸症候群、オピオイド誘発性便秘、及び炎症性腸疾患からなる群から選択される、請求項2に記載の組成物。

【請求項4】

病状又は障害が、神経系に関連し、神経保護から利益を得ることができる、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

病状又は障害が、パーキンソン病、アルツハイマー病、ハンチントン病、中枢神経系に対する急性外傷性損傷、脳卒中、急性頭部損傷、脊椎損傷、加齢に伴う変性プロセス、加齢による認知症、脳性麻痺、てんかん、末梢性感覚ニューロパチー、及び多発性硬化症からなる群から選択される、請求項4に記載の組成物。

【請求項6】

病状又は障害が、うつ、てんかん、自閉症、糖尿病又は糖尿病性ニューロパチーである、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

病状又は障害が、悪性病変である、請求項1に記載の組成物。

【請求項8】

悪性病変が、血管形成されている及び転移性である、請求項7に記載の組成物。

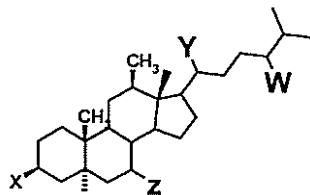
【請求項9】

悪性病変が、結腸、膵臓、肝臓、脳、男性及び女性泌尿生殖器、リンパ及び血管組織、肺、皮膚、胸、及び子宮内膜からなる群から選択される、請求項7又は8に記載の組成物。

【請求項10】

化合物が、ストレス線維形成を誘導することが公知のリガンドによって刺激された内皮細胞におけるアクチンストレス線維の形成を阻害することができ、式1：

【化1】



[式中、

Wは、24S-OSO₃又は24R-OSO₃であり、

Xは、3-H₂N-(CH₂)₄-NH-(CH₂)₃-NH-又は3-H₂N-(CH₂)₄-NH-(CH₂)₃-NH-であり、

Yは、20R-CH₃であり、

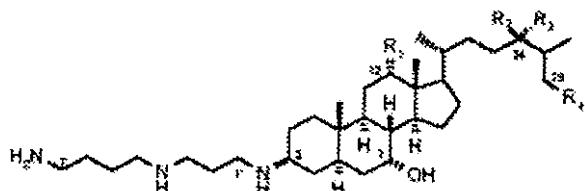
Ζは、7 又は7-OHである]

の化学構造を有するアミノステロールである、請求項1から9のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 1】

アミノステロールが、アブラツノザメ(*Squalus acanthias*)から単離される関連化合物(化合物1~8):

【化 2】

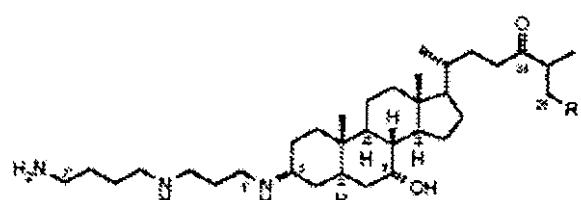


2: R₁=H, R₂=OH, R₃=H, R₄=OSO₃H

4: R₁=OH, R₂=OSO₃H, R₃=H, R₄=H

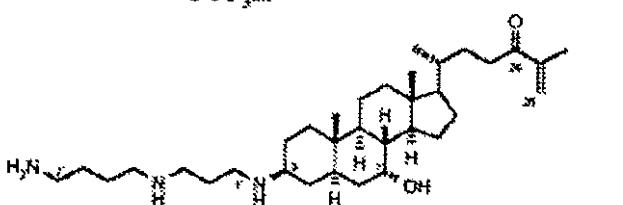
5: R₁=H, R₂=OSO₃H, R₃=CH₂OH, R₄=H

8: R₁=H, R₂=OSO₃H, R₃=H, R₄=H

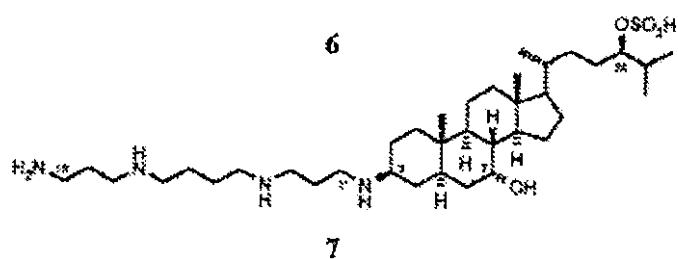


1: R=SCH₂CH(NH₂)CO₂H

3: R=OSO₃H



6



7

のファミリーによって表される、請求項1から10のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 2】

アミノステロールが、アミノステロール1436である、請求項1から10のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 3】

アミノステロールが、

(a)スクアラミン異性体であるか、

(b)ステロール核と、分子がポリアミンの寄与による少なくとも+1の正味の電荷を示すようにステロールのいずれかの位置に結合しているポリアミンとを含むか、

(c)胆汁酸核と、分子がポリアミンの寄与による少なくとも+1の正味の電荷を示すよう

に胆汁酸のいずれかの位置に結合しているポリアミンとを含むか、

(d) (1)スルフェート部分の代謝的除去及びコレステロール側鎖の酸化を回避するための、スルフェートのスルホネート、ホスフェート、カルボキシレート、又は他の選択されたアニオン性部分による置換、(2)代謝的酸化又は抱合を防ぐための、ヒドロキシル基の非代謝性極性置換基、例えばフッ素原子による置き換え、並びに (3)ステロイド環系の酸化的又は還元的代謝を防ぐための様々な環水素原子の置換、のうちの1つ以上を含むように改変されているか、または

(e)体内分布、投与の容易性、代謝安定性、又はその任意の組合せを改善するように医化学を通じて改変されたスクアラミン又は天然アミノステロールの誘導体である、請求項1から11のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項14】

有効一日投与量が、約0.1～約20mg/kg体重である、請求項1から13のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項15】

有効用量が、アミノステロール誘導GI応答を誘導するのに必要な初期用量を定めることによって確立され、初期用量が腸管活動の変化、吐き気、分泌性下痢、又はその任意の組合せを刺激するために必要な初期用量である、請求項1から14のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項16】

スクアラミン又はアミノステロールが、相加的又は相乗的効果のいずれかを達成するために少なくとも1つのさらなる活性剤と組み合わせて投与される、請求項1から15のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項17】

さらなる活性剤が、

(a)付随的に、

(b)混合物として、

(c)別個及び同時に又は併行して、並びに

(d)別個及び連続的に

からなる群から選択される方法を介して投与される、請求項16に記載の組成物。

【請求項18】

組成物が、意図する治療利益を達成するために適切な溶解速度で、胃、小腸上部、又はより遠位の腸の部分のいずれかで崩壊するように設計された液剤、カプセル剤又は錠剤の経口剤形である、請求項1から17のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項19】

アミノステロールが、経口投与後の対象の血流中で実質的に検出されない、請求項1から18のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項20】

組成物がさらに少なくとも1つの薬学的に許容される担体を含む、請求項1から19のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項21】

対象がヒトである、請求項1から20のいずれか一項に記載の組成物。