

【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】令和 3 年 6 月 10 日 (2021.6.10)

【公表番号】特表 2020-525425 (P2020-525425A)

【公表日】令和 2 年 8 月 27 日 (2020.8.27)

【年通号数】公開・登録公報 2020-034

【出願番号】特願 2019-570406 (P2019-570406)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|--------|-----------|
| A 6 1 K | 31/125 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/16 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/28 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/16 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 31/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 39/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/04 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/20 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/48 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/14 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/10 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/107 | (2006.01) |
| A 2 3 L | 33/105 | (2016.01) |

【F I】

| | | |
|---------|--------|-------|
| A 6 1 K | 31/125 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 1 1 |
| A 6 1 P | 3/00 | |
| A 6 1 P | 3/10 | |
| A 6 1 P | 9/10 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 1/16 | |
| A 6 1 P | 25/28 | |
| A 6 1 P | 25/16 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 31/12 | |
| A 6 1 P | 39/02 | |
| A 6 1 P | 3/04 | |
| A 6 1 K | 9/20 | |
| A 6 1 K | 9/48 | |
| A 6 1 K | 9/14 | |
| A 6 1 K | 9/10 | |
| A 6 1 K | 9/107 | |
| A 2 3 L | 33/105 | Z N A |

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 4 月 22 日 (2021.4.22)

【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】

アンフォールディング化またはミスフォールディング化細胞タンパク質転写産物の蓄積により特徴づけられる哺乳類細胞において小胞体ストレスを処理するための医薬組成物であって、前記アンフォールディング化またはミスフォールディング化タンパク質転写産物の蓄積を減衰させる効果を引き起こす、有効濃度のガルシノールを含む、医薬組成物。

【請求項 2】

ガルシノールの有効濃度が $2 \sim 10 \mu\text{g} / \text{ml}$ である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

哺乳類細胞がヒト細胞である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

哺乳類において小胞体ストレスおよび関連した毒性を低下させるための医薬組成物であって、毒性および小胞体ストレスマーカーの低下を引き起こす、有効濃度のガルシノールを含む、医薬組成物。

【請求項 5】

小胞体ストレスが、メタボリックシンドローム、糖尿病、アテローム性動脈硬化症、アルツハイマー病およびパーキンソン病のような神経変性障害、アルコール性および非アルコール性脂肪肝、癌、ウイルス感染症、高血糖症、薬剤誘発性毒性、ならびに肥満症からなる群から選択される臨床状態に存在する、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

小胞体ストレスのマーカーが SXB P 、 $\text{ATF} - 4$ 、および $\text{GRP} 78$ からなる群から選択される、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

ガルシノールの有効濃度が $0.1 \sim 5 \text{mg} / \text{kg}$ 体重である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

哺乳類がヒトである、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

薬学的に / 栄養補助的に許容される賦形剤、補助剤、希釈剤、または担体と共に製剤化され、かつ錠剤、カプセル、シロップ、グミ、粉末、懸濁液、乳濁液、チュアブル、キャンディ、または食料品の形をとって経口投与される、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

小胞体ストレス誘発性メタボリックシンドロームの治療管理のための医薬組成物であって、前記メタボリックシンドロームの症状をもたらすアンフォールディング化またはミスフォールディング化タンパク質転写産物の蓄積を減衰させる効果を引き起こす、有効濃度のガルシノールを含む、医薬組成物。

【請求項 11】

メタボリックシンドロームが、糖尿病、アテローム性動脈硬化症、アルツハイマー病およびパーキンソン病のような神経変性障害、アルコール性および非アルコール性脂肪肝、癌、ウイルス感染症、高血糖症、薬剤誘発性毒性、ならびに肥満症からなる群から選択される臨床状態に存在する、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

ガルシノールの有効濃度が $0.1 \sim 5 \text{mg} / \text{kg}$ 体重である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

哺乳類がヒトである、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

薬学的に／栄養補助的に許容される賦形剤、補助剤、希釈剤、または担体と共に製剤化され、かつ錠剤、カプセル、シロップ、グミ、粉末、懸濁液、乳濁液、チュアブル、キャンディ、または食料品の形をとって経口投与される、請求項 10 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】0027

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0027】

本発明への他の改変およびバリエーションは、前述の開示および教示から当業者に明らかであろう。したがって、本発明のある特定の実施形態だけが本明細書に具体的に記載されているが、多数の改変が、本発明の精神および範囲から逸脱することなく、それらになされ得ることは明らかである。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕アンフォールディング化またはミスフォールディング化細胞タンパク質転写産物の蓄積により特徴づけられる哺乳類細胞において小胞体ストレスを処理する方法であって、前記哺乳類細胞を有効濃度のガルシノールで処理して、前記アンフォールディング化またはミスフォールディング化タンパク質転写産物の蓄積を減衰させる効果を引き起こすステップを含む、方法。

〔2〕ガルシノールの有効濃度が $2 \sim 10 \mu\text{g}/\text{ml}$ である、前記〔1〕に記載の方法。

〔3〕哺乳類細胞が好ましくはヒト細胞である、前記〔1〕に記載の方法。

〔4〕哺乳類において小胞体ストレスおよび関連した毒性を低下させるための方法であって、有効濃度のガルシノールを前記哺乳類に投与して、毒性および小胞体ストレスマーカーの低下を引き起こすステップを含む、方法。

〔5〕小胞体ストレスが、メタボリックシンドローム、糖尿病、アテローム性動脈硬化症、アルツハイマー病およびパーキンソン病のような神経変性障害、アルコール性および非アルコール性脂肪肝、癌、ウイルス感染症、高血糖症、薬剤誘発性毒性、ならびに肥満症からなる群から選択される臨床状態に存在する、前記〔4〕に記載の方法。

〔6〕小胞体ストレスのマーカーが SXB P 、 ATF-4 、および GRP78 からなる群から選択される、前記〔4〕に記載の方法。

〔7〕ガルシノールの有効濃度が $0.1 \sim 5 \text{mg}/\text{kg}$ 体重である、前記〔4〕に記載の方法。

〔8〕哺乳類がヒトである、前記〔4〕に記載の方法。

〔9〕ガルシノールが、薬学的に／栄養補助的に許容される賦形剤、補助剤、希釈剤、または担体と共に組成物として製剤化され、かつ錠剤、カプセル、シロップ、グミ、粉末、懸濁液、乳濁液、チュアブル、キャンディ、および食料品の形をとって経口投与される、前記〔4〕に記載の方法。

〔10〕小胞体ストレス誘発性メタボリックシンドロームの治療管理の方法であって、有効濃度のガルシノールを前記哺乳類に投与して、メタボリックシンドロームの症状をもたらす前記アンフォールディング化またはミスフォールディング化タンパク質転写産物の蓄積を減衰させる効果を引き起こすステップを含む、方法。

〔11〕メタボリックシンドロームが、糖尿病、アテローム性動脈硬化症、アルツハイマー病およびパーキンソン病のような神経変性障害、アルコール性および非アルコール性脂肪肝、癌、ウイルス感染症、高血糖症、薬剤誘発性毒性、ならびに肥満症からなる群から選択される臨床状態に存在する、前記〔10〕に記載の方法。

〔12〕ガルシノールの有効濃度が $0.1 \sim 5 \text{mg}/\text{kg}$ 体重である、前記〔10〕に記載の方法。

〔13〕哺乳類がヒトである、前記〔10〕に記載の方法。

〔 １ ４ 〕 ガルシノールが、薬学的に／栄養補助的に許容される賦形剤、補助剤、希釈剤、または担体と共に組成物として製剤化され、かつ錠剤、カプセル、シロップ、グミ、粉末、懸濁液、乳濁液、チュアブル、キャンディ、および食料品の形をとって経口投与される、前記〔 １ ０ 〕に記載の方法。