

【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4年12月21日(2022.12.21)

【公開番号】特開2022-88642(P2022-88642A)

【公開日】令和4年6月14日(2022.6.14)

【年通号数】公開公報(特許)2022-106

【出願番号】特願2022-63285(P2022-63285)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00(2006.01)

10

A 6 1 K 31/52(2006.01)

A 6 1 P 9/10(2006.01)

A 6 1 P 9/00(2006.01)

A 6 1 P 25/00(2006.01)

A 6 1 P 25/06(2006.01)

A 6 1 P 25/14(2006.01)

A 6 1 P 25/16(2006.01)

A 6 1 P 25/28(2006.01)

A 6 1 P 29/00(2006.01)

A 6 1 P 37/02(2006.01)

20

A 6 1 P 43/00(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/52

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

30

【手続補正書】

【提出日】令和4年12月13日(2022.12.13)

【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

40

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

A₃ アデノシン受容体のアゴニスト(A₃Rアゴニスト)を含む、外傷性脳傷害(TBI)、脳卒中、神経変性状態、および心疾患または心血管疾患から選択される傷害、疾患、または状態を処置するための組成物であって、

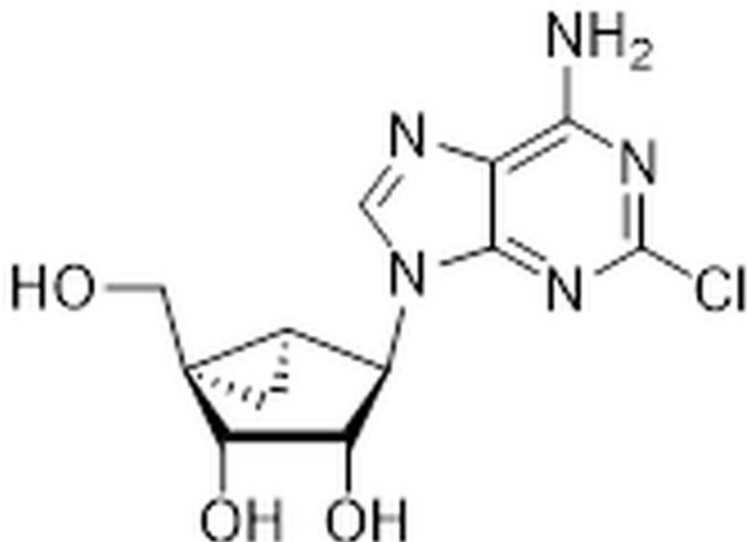
前記神経変性状態が、アルツハイマー病(AD)、パーキンソン病(PD)、ハンチントン病(HD)、多発性硬化症(MS)、筋萎縮性側索硬化症(ALS)、慢性外傷性脳症(CTE)、および外傷性脳障害、脳振盪、脳卒中、部分的もしくは全体的脊髄離断、

50

栄養障害、毒性神経障害、髄膜脳炎、遺伝的障害、加齢性神経変性、ウイルス、アルコール依存症、腫瘍、毒素もしくは反復性脳傷害によって引き起こされた神経変性状態から選択され、

前記心疾患または心血管疾患が、心虚血、心筋梗塞、心筋症、不整脈、心筋炎、心膜炎、アンギナ、心内膜炎、およびアテローム性動脈硬化症から選択され、

前記 A₃R アゴニストが、



10

20

または薬学的に許容されるその塩である、組成物。

【請求項 2】

前記傷害、疾患、または状態が、TBI である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記 TBI が、脳振盪、爆傷、戦闘関連傷害、または頭部への軽度、中程度もしくは重度の衝撃から選択される、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記傷害、疾患、または状態が、脳卒中である、請求項 1 に記載の組成物。

30

【請求項 5】

前記傷害、疾患、または状態が、虚血性脳卒中、出血性脳卒中、くも膜下出血、脳血管攣縮、または一過性脳虚血発作 (TIA) から選択される脳卒中である、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記傷害、疾患、または状態が、アルツハイマー病 (AD)、パーキンソン病 (PD)、および筋萎縮性側索硬化症 (ALS) から選択される神経変性状態である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記神経変性状態が、アルツハイマー病 (AD) である、請求項 6 に記載の組成物。

40

【請求項 8】

前記患者の神経保護または神経修復が、未処置患者と比較して増大する、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 9】

前記傷害、疾患、または状態が、心虚血および心筋梗塞から選択される心疾患または心血管疾患である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記組成物が、脳卒中、心虚血、または心筋梗塞を処置するために、前記傷害が生じた後、その傷害が回復する期間中、慢性的に投与される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

50

前記 T B I、脳卒中、心虚血、または心筋梗塞後の回復期間が、未処置患者と比較して短縮される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

前記組成物が、経口、静脈内、または非経口投与される、請求項 1 ~ 7 または 9 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 3】

前記 A₃R アゴニストまたは薬学的に許容されるその塩が、血漿中で少なくとも 0 . 7 の非結合画分を有するか、または脳内で少なくとも 0 . 0 8 の非結合画分を有するか、またはその両方である、請求項 1 ~ 7 または 9 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 4】

前記患者が T B I または脳卒中に罹患しており、前記組成物が前記 T B I または脳卒中後 2 4 時間以内に投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 5】

前記患者が T B I または脳卒中に罹患しており、前記組成物が前記 T B I または脳卒中後 8 時間以内に投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 6】

前記患者が T B I または脳卒中に罹患しており、前記組成物が前記 T B I または脳卒中後少なくとも最初の 8 ~ 4 8 時間の間に投与される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 7】

前記 A₃R が、部分的にアゴナイズされる、請求項 1 ~ 7 または 9 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の組成物。

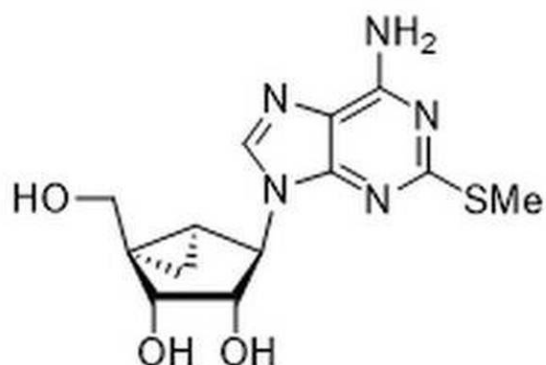
【請求項 1 8】

A₃ アデノシン受容体のアゴニスト (A₃R アゴニスト) を含む、神経変性状態、および心疾患または心血管疾患から選択される傷害、疾患、または状態を処置するための組成物であって、

前記神経変性状態が、アルツハイマー病 (A D)、パーキンソン病 (P D)、ハンチントン病 (H D)、多発性硬化症 (M S)、筋萎縮性側索硬化症 (A L S)、慢性外傷性脳症 (C T E)、および外傷性脳障害、脳振盪、脳卒中、部分的もしくは全体的脊髄離断、栄養障害、毒性神経障害、髄膜脳炎、遺伝的障害、加齢性神経変性、ウイルス、アルコール依存症、腫瘍、毒素もしくは反復性脳傷害によって引き起こされた神経変性状態から選択され、

前記心疾患または心血管疾患が、心虚血、心筋梗塞、心筋症、不整脈、心筋炎、心膜炎、アンギナ、心内膜炎、およびアテローム性動脈硬化症から選択され、

前記 A₃R アゴニストが、



10

20

30

40

50

または薬学的に許容されるその塩である、組成物。

【請求項 19】

前記神経変性状態が、アルツハイマー病 (AD)、パーキンソン病 (PD)、または筋萎縮性側索硬化症 (ALS) である、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記神経変性状態が、アルツハイマー病 (AD) である、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記傷害、疾患、または状態が、心虚血および心筋梗塞から選択される心疾患または心血管疾患である、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 22】

前記組成物が、心虚血または心筋梗塞を処置するために、前記傷害が生じた後、その傷害が回復する期間中、慢性的に投与される、請求項 21 に記載の組成物。

10

【請求項 23】

前記心虚血または心筋梗塞後の回復期間が、未処置患者と比較して短縮される、請求項 21 に記載の組成物。

【請求項 24】

前記組成物が、経口、静脈内、または非経口投与される、請求項 18 ~ 23 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 25】

前記 A₃R アゴニストまたは薬学的に許容されるその塩が、血漿中で少なくとも 0.7 の非結合画分を有するか、または脳内で少なくとも 0.08 の非結合画分を有するか、またはその両方である、請求項 18 ~ 23 のいずれか一項に記載の組成物。

20

【請求項 26】

前記 A₃R が、部分的にアゴナイズされる、請求項 18 ~ 23 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 27】

A₃ アデノシン受容体のアゴニスト (A₃R アゴニスト) を含む、傷害、疾患、または状態を処置するための組成物であって、

前記傷害、疾患、または状態が、

(i) 放射線によって引き起こされた脳損傷；

30

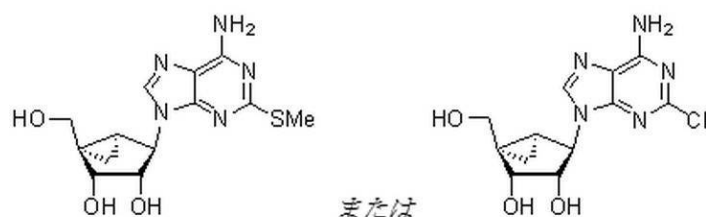
(ii) 片頭痛；

(iii) うつ病、気分もしくは行動の変化、認知症、移り気な行動、自殺傾向、振戦、ハンチントン舞踏病、運動協調の喪失、聴覚消失、発語障害、ドライアイ、軽躁病、注意欠陥、記憶喪失、認知困難もしくは認知障害、CNS 機能障害、学習障害、めまい、構音障害、嚥下障害、眼の異常、および見当識障害から選択される脳傷害または神経変性状態に関連する状態；

(iv) 自己免疫疾患、緑内障、聴覚障害、進行性聴覚消失、耳鳴り、てんかん、疼痛管理、中枢神経系によって媒介される疼痛、神経障害性疼痛、炎症性疼痛、または急性疼痛

から選択され、前記 A₃R アゴニストが、

40

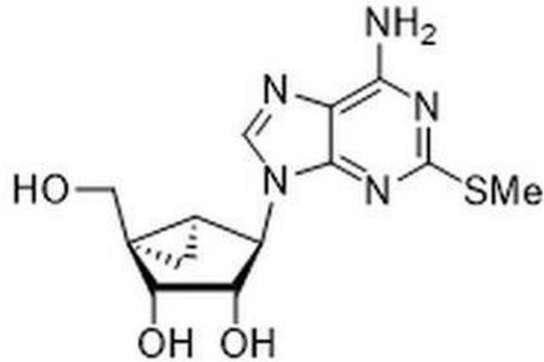


または薬学的に許容されるその塩から選択される、組成物。

50

【請求項 28】

前記 A₃R アゴニストが、

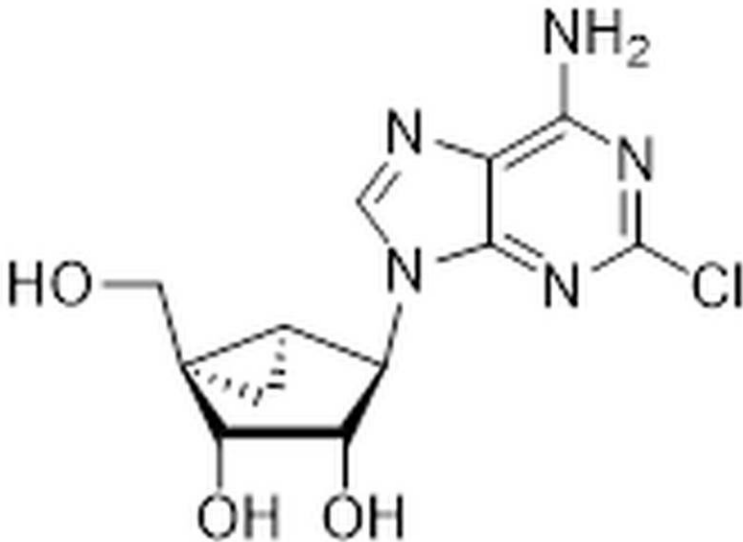


10

または薬学的に許容されるその塩である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記 A₃R アゴニストが、



30

または薬学的に許容されるその塩である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 30】

前記患者の神経保護または神経修復が、未処置患者と比較して増大する、請求項 27 ~ 29 のいずれか一項に記載の組成物。

40

【請求項 31】

前記傷害、疾患、または状態が、てんかん、片頭痛、うつ病、気分もしくは行動の変化、認知症、振戦、運動協調の喪失、聴覚消失、発語障害、軽躁病、注意欠陥、記憶喪失、認知困難もしくは認知障害、CNS機能障害、学習障害、めまい、構音障害、嚥下障害、または見当識障害から選択される、請求項 27 ~ 29 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 32】

前記傷害、疾患、または状態が、認知困難または認知障害、CNS機能障害、学習障害、および記憶喪失から選択される、請求項 27 ~ 29 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 33】

50

前記患者が外傷性脳傷害（TBI）を受けている、請求項32に記載の組成物。

【請求項34】

前記傷害、疾患、または状態が、疼痛管理、CNSによって媒介される疼痛、神経障害性疼痛、炎症性疼痛、または急性疼痛である、請求項27～29のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項35】

前記傷害、疾患、または状態が、CNSによって媒介される疼痛または神経障害性疼痛である、請求項27～29のいずれか一項に記載の組成物。

10

20

30

40

50