

【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28年5月12日 (2016.5.12)

【公表番号】特表2015-512393(P2015-512393A)

【公表日】平成27年4月27日 (2015.4.27)

【年通号数】公開・登録公報2015-028

【出願番号】特願2015-501792(P2015-501792)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/58 (2006.01)

A 6 1 K 31/403 (2006.01)

A 6 1 K 31/405 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 31/435 (2006.01)

A 6 1 K 31/5575 (2006.01)

A 6 1 Q 7/00 (2006.01)

A 6 1 Q 7/02 (2006.01)

A 6 1 K 8/63 (2006.01)

A 6 1 K 8/49 (2006.01)

A 6 1 K 8/36 (2006.01)

A 6 1 K 8/35 (2006.01)

G 0 1 N 33/50 (2006.01)

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 17/00

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/58

A 6 1 K 31/403

A 6 1 K 31/405

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 31/435

A 6 1 K 31/5575

A 6 1 Q 7/00

A 6 1 Q 7/02

A 6 1 K 8/63

A 6 1 K 8/49

A 6 1 K 8/36

A 6 1 K 8/35

G 0 1 N 33/50 Z

G 0 1 N 33/15 Z

【手続補正書】

【提出日】平成28年3月11日 (2016.3.11)

【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】

対象における発毛を調節するための組成物であって、有効量の D P - 2 作動薬または拮抗薬を含む、組成物。

【請求項 2】

局所的に投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

D P - 2 作動薬を含む、請求項 1 に記載の組成物であって、発毛調節が発毛阻害である、組成物。

【請求項 4】

D P - 2 拮抗薬を含む、請求項 1 に記載の組成物であって、発毛調節が発毛刺激である、組成物。

【請求項 5】

対象における発毛を刺激するための組成物であって、有効量の D P - 2 拮抗薬を含む、組成物。

【請求項 6】

局所的に投与されることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記組成物が、前記対象に発毛を調節する別の作用剤と合わせて投与されることを特徴とし、前記別の作用剤がフィナステリドまたはミノキシジルである、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 8】

毛包が前記対象に移植されることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記対象における皮膚の真皮または表皮が除去されることを特徴とする、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 10】

対象が男性型脱毛症を有する、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 11】

対象が円板状エリテマトーデス (discoid lupus erythematosis)、先天性貧毛症、毛孔性扁平苔癬または瘢痕性脱毛症に関連する脱毛を有する、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 12】

D P - 2 拮抗薬が D P - 1 に対する選択的 D P - 2 拮抗薬である、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記拮抗薬が D P - 2 に対し 1 0 0 n M 以下の  $IC_{50}$  を有する、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 14】

D P - 2 拮抗薬がラマトロバンまたはその類似体である、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 15】

D P - 2 拮抗薬がインドール酢酸誘導体である、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 16】

D P - 2 拮抗薬がフェニル酢酸誘導体である、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 17】

D P - 2 拮抗薬がテトラヒドロキノリン (tetrahydroquinoline) 誘導体である、請求項 5 に記載の組成物。

## 【請求項 18】

対象における発毛を阻害するための組成物であって、有効量のDP-2作動薬を含む、組成物。

## 【請求項 19】

局所的に投与されることを特徴とする、請求項 18 に記載の組成物。

## 【請求項 20】

前記対象の皮膚上の毛髪が除去されることを特徴とする、請求項 18 に記載の組成物。

## 【請求項 21】

DP-2作動薬がDP-1に対する選択的DP-2作動薬である、請求項 18 に記載の組成物

## 【請求項 22】

DP-2作動薬が15(R)PGD<sub>2</sub>、15(R)-15-メチルPGD<sub>2</sub>および13, 14-ジヒドロ-15-オキソPGD<sub>2</sub>からなる群から選択される、請求項 18 に記載の組成物。

## 【請求項 23】

DP-2作動薬がDP-2に対し100nM以下のEC<sub>50</sub>を有する、請求項 18 に記載の組成物。

## 【請求項 24】

対象における発毛を調節するための組成物であって、前記対象における発毛を調節するのに有効な量でDP-2作動薬または拮抗薬を含む、上記組成物。

## 【請求項 25】

組成物がDP-2作動薬または拮抗薬の局所製剤である、請求項 24 に記載の組成物。

## 【請求項 26】

対象における発毛を刺激するための組成物であって、前記対象における発毛を刺激するのに有効な量でDP-2拮抗薬を含む、上記組成物。

## 【請求項 27】

組成物がDP-2拮抗薬の局所製剤である、請求項 26 に記載の組成物。

## 【請求項 28】

対象における男性型脱毛症または脱毛症または毛髪脱落を治療するための組成物であって、前記対象における前記男性型脱毛症または脱毛症または毛髪脱落を治療するのに有効な量でDP-2拮抗薬を含む、上記組成物。

## 【請求項 29】

組成物がDP-2拮抗薬の局所製剤である、請求項 28 に記載の組成物。

## 【請求項 30】

対象における発毛を阻害するための組成物であって、前記対象における発毛を阻害するのに有効な量でDP-2作動薬を含む、上記組成物。

## 【請求項 31】

組成物がDP-2作動薬の局所製剤である、請求項 30 に記載の組成物。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0016

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0016】

本発明の他の特徴および利点は、以下の発明を実施するための形態、実施例および図面から明らかとなる。本発明の精神および範囲に含まれる種々の変更および改変がこの発明を実施するための形態から当業者には明らかとなることから、発明を実施するための形態および具体例が、好ましい本発明の実施形態を示す一方で、例示としてのみ与えられていることを理解されたい。

例えば、本発明は、以下の項目を提供する：

(項目 1)

対象における発毛を調節する方法であって、上記対象に有効量の D P - 2 作動薬または拮抗薬を投与することを含む、上記方法。

(項目 2)

投与ステップが局所的に行われる、項目 1 に記載の方法。

(項目 3)

発毛調節が発毛阻害であり、D P - 2 作動薬を投与することを含む、項目 1 に記載の方法。

(項目 4)

発毛調節が発毛刺激であり、D P - 2 拮抗薬を投与することを含む、項目 1 に記載の方法。

(項目 5)

対象における発毛を刺激するための方法であって、上記対象に有効量の D P - 2 拮抗薬を投与することを含む、上記方法。

(項目 6)

投与ステップが局所的に行われる、項目 5 に記載の方法。

(項目 7)

上記対象に発毛を調節する別の作用剤を投与することをさらに含み、上記別の作用剤がフィナステリドまたはミノキシジルである、項目 5 に記載の方法。

(項目 8)

毛包を上記対象に移植するステップをさらに含む、項目 5 に記載の方法。

(項目 9)

上記対象における皮膚の真皮または表皮を除去することをさらに含む、項目 5 に記載の方法。

(項目 10)

対象が男性型脱毛症を有する、項目 5 に記載の方法。

(項目 11)

対象が円板状エリテマトーデス (discoid lupus erythematosis)、先天性貧毛症、毛孔性扁平苔癬または瘢痕性脱毛症に関連する脱毛を有する、項目 5 に記載の方法。

(項目 12)

D P - 2 拮抗薬が D P - 1 に対する選択的 D P - 2 拮抗薬である、項目 5 に記載の方法。

(項目 13)

拮抗薬が D P - 2 に対し 100 nM 以下の  $IC_{50}$  を有する、項目 5 に記載の方法。

(項目 14)

D P - 2 拮抗薬がラマトロバンまたはその類似体である、項目 5 に記載の方法。

(項目 15)

D P - 2 拮抗薬がインドール酢酸誘導体である、項目 5 に記載の方法。

(項目 16)

D P - 2 拮抗薬がフェニル酢酸誘導体である、項目 5 に記載の方法。

(項目 17)

D P - 2 拮抗薬がテトラヒドロキノリン (tetrahydroquinoline) 誘導体である、項目 5 に記載の方法。

(項目 18)

対象における発毛を阻害するための方法であって、上記対象に有効量の D P - 2 作動薬を投与することを含む、上記方法。

(項目 19)

投与ステップが局所的に行われる、項目 18 に記載の方法。

(項目 20)

上記対象の皮膚上の毛髪を除去することをさらに含む、項目 18 に記載の方法。

(項目 21)

DP - 2 作動薬が DP - 1 に対する選択的 DP - 2 作動薬である、項目 18 に記載の方法

(項目 22)

DP - 2 作動薬が 15 (R) PGD<sub>2</sub>、15 (R) - 15 - メチル PGD<sub>2</sub> および 13, 14 - ジヒドロ - 15 - オキソ PGD<sub>2</sub> からなる群から選択される、項目 18 に記載の方法。

(項目 23)

DP - 2 作動薬が DP - 2 に対し 100 nM 以下の EC<sub>50</sub> を有する、項目 18 に記載の方法。

(項目 24)

対象における発毛を調節するための組成物であって、上記対象における発毛を調節するのに有効な量で DP - 2 作動薬または拮抗薬を含む、上記組成物。

(項目 25)

組成物が DP - 2 作動薬または拮抗薬の局所製剤である、項目 24 に記載の組成物。

(項目 26)

対象における発毛を刺激するための組成物であって、上記対象における発毛を刺激するのに有効な量で DP - 2 拮抗薬を含む、上記組成物。

(項目 27)

組成物が DP - 2 拮抗薬の局所製剤である、項目 26 に記載の組成物。

(項目 28)

対象における男性型脱毛症または脱毛症または毛髪脱落を治療するための組成物であって、上記対象における上記男性型脱毛症または脱毛症または毛髪脱落を治療するのに有効な量で DP - 2 拮抗薬を含む、上記組成物。

(項目 29)

組成物が DP - 2 拮抗薬の局所製剤である、項目 28 に記載の組成物。

(項目 30)

対象における発毛を阻害するための組成物であって、上記対象における発毛を阻害するのに有効な量で DP - 2 作動薬を含む、上記組成物。

(項目 31)

組成物が DP - 2 作動薬の局所製剤である、項目 30 に記載の組成物。

(項目 32)

男性型脱毛症を治療するための候補作用剤として化合物をスクリーニングするための方法であって、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下、且つプロスタグランジン D<sub>2</sub> の存在下で、DP - 2 活性を測定し；同じ条件下で、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であると考えられる化合物の非存在下、且つプロスタグランジン D<sub>2</sub> の存在下で、DP - 2 活性を測定するステップを含み、上記化合物の非存在下におけるよりも上記化合物の存在下におけるより低い DP - 2 活性が、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であることを示す、上記方法。

(項目 33)

男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下、且つプロスタグランジン D<sub>2</sub> の存在下で、DP - 1 活性を測定し；同じ条件下で、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であると考えられる化合物の非存在下、且つプロスタグランジン D<sub>2</sub> の存在下で、DP - 1 活性を測定するステップをさらに含み、上記化合物の存在下および非存在下でのより低い DP - 2 活性およびおよそ等しい DP - 1 活性が、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であることを示す、項目 32 に記載の方法。

(項目 34)

発毛を刺激するための候補作用剤として化合物をスクリーニングするための方法であって、発毛を刺激するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下、且つプロスタ

グランジン D 2 の存在下で、D P - 2 活性を測定し；同じ条件下で、発毛を刺激するための候補作用剤であると考えられる化合物の非存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 2 活性を測定するステップを含み、上記化合物の非存在下におけるよりも上記化合物の存在下におけるより低い D P - 2 活性が、発毛を刺激するための候補作用剤であることを示す、上記方法。

( 項目 3 5 )

発毛を刺激するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 1 活性を測定し；同じ条件下で、発毛を刺激するための候補作用剤であると考えられる化合物の非存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 1 活性を測定するステップをさらに含み、上記化合物の存在下および非存在下でのより低い D P - 2 活性およびおよそ等しい D P - 1 活性が、発毛を刺激するための候補作用剤であることを示す、項目 3 4 に記載の方法。

( 項目 3 6 )

発毛を阻害するための候補作用剤として化合物をスクリーニングする方法であって、発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下で D P - 2 活性を測定し；同じ条件下で、プロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 2 活性を測定するステップを含み、プロスタグランジン D 2 の存在下での D P - 2 活性と等しいまたはそれよりも大きな、発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる上記化合物の D P - 2 活性が、発毛を阻害するための候補作用剤であることを示す、上記方法。

( 項目 3 7 )

発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下で、D P - 1 活性を測定し；同じ条件下で、プロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 1 活性を測定するステップをさらに含み、プロスタグランジン D 2 の存在下での D P - 2 活性と等しいまたはそれよりも大きな、発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる上記化合物の D P - 2 活性、およびプロスタグランジン D 2 の存在下での D P - 1 活性と等しいまたはそれ未満である、発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる上記化合物の D P - 1 活性が、発毛を阻害するための候補作用剤であることを示す、項目 3 6 に記載の方法。

。

( 項目 3 8 )

男性型脱毛症を治療するための候補作用剤として複数の化合物をスクリーニングするための方法であって、複数の化合物の各化合物について、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 2 活性を測定し；同じ条件下で、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であると考えられる化合物の非存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 2 活性を測定するステップを含み、上記化合物の非存在下におけるよりも上記化合物の存在下におけるより低い D P - 2 活性が、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であることを示す、上記方法。

( 項目 3 9 )

複数の化合物の各化合物について、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で D P - 1 活性を測定し；同じ条件下で、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であると考えられる化合物の非存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 1 活性を測定するステップをさらに含み、上記化合物の存在下および非存在下でのより低い D P - 2 活性およびおよそ等しい D P - 1 活性が、男性型脱毛症を治療するための候補作用剤であることを示す、項目 3 8 に記載の方法。

( 項目 4 0 )

発毛を刺激するための候補作用剤として複数の化合物をスクリーニングするための方法であって、複数の化合物の各化合物について、発毛を刺激するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 2 活性を測定し；同じ条件下で、発毛を刺激するための候補作用剤であると考えられる化合物の非存

在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 2 活性を測定するステップを含み、上記化合物の非存在下におけるよりも上記化合物の存在下におけるより低い D P - 2 活性が、発毛を刺激するための候補作用剤であることを示す、上記方法。

( 項目 4 1 )

複数の化合物の各化合物について、発毛を刺激するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 1 活性を測定し；同じ条件下で、発毛を刺激する候補作用剤であると考えられる化合物の非存在下、且つプロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 1 活性を測定するステップをさらに含み、より低い D P - 2 活性、および上記化合物の非存在下におけるよりも上記化合物の存在下におけるおよそ等しい D P - 1 活性が、発毛を刺激するための候補作用剤であることを示す、項目 4 0 に記載の方法。

( 項目 4 2 )

発毛を阻害するための候補作用剤として複数の化合物をスクリーニングするための方法であって、複数の化合物の各化合物について、発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下で、D P - 2 活性を測定し；同じ条件下で、プロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 2 活性を測定するステップを含み、プロスタグランジン D 2 の存在下での D P - 2 活性と等しいまたはそれよりも大きな発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる上記化合物の D P - 2 活性が、発毛を阻害するための候補作用剤であることを示す、上記方法。

( 項目 4 3 )

複数の化合物の各化合物について、発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる化合物の存在下で、D P - 1 活性を測定し；同じ条件下で、プロスタグランジン D 2 の存在下で、D P - 1 活性を測定するステップをさらに含み、プロスタグランジン D 2 の存在下での D P - 2 活性と等しいまたはそれよりも大きな、発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる上記化合物の D P - 2 活性、およびプロスタグランジン D 2 の存在下での D P - 1 活性と等しいまたはそれ未満である、発毛を阻害するための候補作用剤であると考えられる上記化合物の D P - 1 活性が、発毛を阻害するための候補作用剤であることを示す、項目 4 2 に記載の方法。