

【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 19 年 3 月 1 日 (2007.3.1)

【公表番号】特表 2006-516280 (P2006-516280A)

【公表日】平成 18 年 6 月 29 日 (2006.6.29)

【年通号数】公開・登録公報 2006-025

【出願番号】特願 2006-500735 (P2006-500735)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/688 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 2 3 L 1/30 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/688

A 6 1 P 3/06

A 2 3 L 1/30 Z

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 1 月 11 日 (2007.1.11)

【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

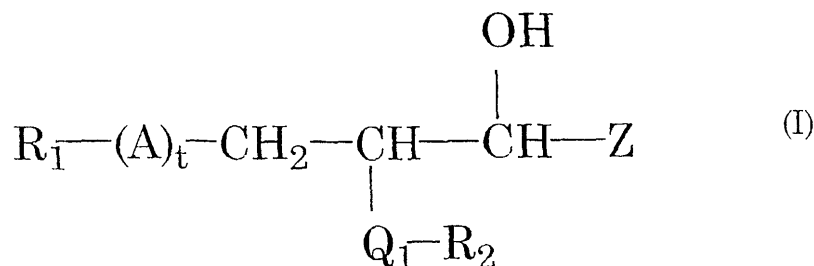
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

対象におけるコレステロール及びトリグリセリドのレベルを減少するための剤であって、一般式 (I)



(ここで、

Z が、R<sub>3</sub> 又は -CH(OH)-R<sub>3</sub> であり；

A が、サルフェート、サルフォネート、フォスフェート、フォスフォネート又は -C(O)O- であり；

R<sub>1</sub> が、水素、水酸基、アルジトール、アルドース、アルコール、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル又はアミノ酸残基であり；

R<sub>2</sub> が、水素、又は不飽和若しくは飽和 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>30</sub>) アルキル鎖であり；

R<sub>3</sub> が、不飽和又は飽和 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>30</sub>) アルキル鎖であり；

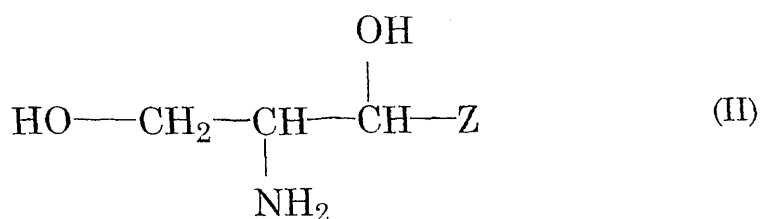
Q<sub>1</sub> が、第一級アミノ基 (-NH<sub>2</sub>)、第二級アミノ基 (-NH-) 又はアミド基 (-NH-CO-) であり；及び

t が、0 又は 1 である) を有するスフィンゴ脂質又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩を含む剤。

【請求項 2】

対象におけるコレステロール及びトリグリセリドのレベルを減少するための剤で

あって、一般式 (II)



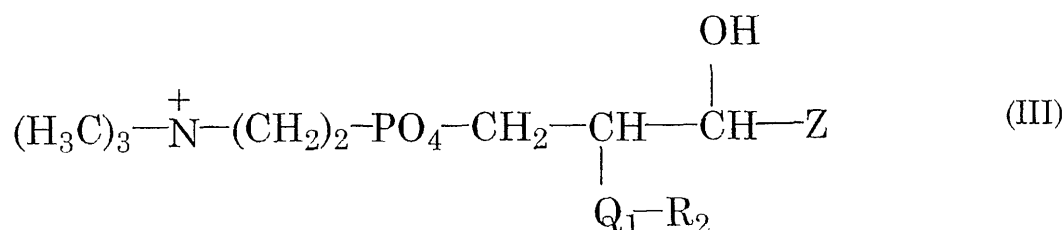
(ここで、

Z が、 $\text{R}_3$  又は  $\text{CH}(\text{OH})-\text{R}_3$  であり、及び

$\text{R}_3$  が、不飽和又は飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖である) に従うスフィンゴ脂質又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩を含む剤。

【請求項 3】

対象におけるコレステロール及びトリグリセリドのレベルを減少するための剤であって、一般式 (III)



(ここで、

Z が、 $\text{R}_3$  又は  $\text{CH}(\text{OH})-\text{R}_3$ 、好ましくは  $\text{R}_3$  であり；

$\text{Q}_1$  が、第一級アミノ基 ( $-\text{NH}_2$ )、第二級アミノ基 ( $-\text{NH}-$ ) 又はアミド基 ( $-\text{NH}-\text{CO}-$ )、好ましくはアミド基であり；

$\text{R}_2$  が、水素、又は不飽和若しくは飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖であり；

$\text{R}_3$  が、不飽和又は飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖、好ましくは不飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖である) に従うスフィンゴ脂質又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩を含む剤。

【請求項 4】

食品において、血漿及び / 又は血清コレステロール及びトリグリセリドを低下させる剤として、請求項 1 に定義された式 (I) 若しくは請求項 2 に定義された式 (II) 若しくは請求項 3 に定義された式 (III) に従うスフィンゴ脂質、又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩を含む剤。

【請求項 5】

前記スフィンゴ脂質が、フィツスフィンゴシン、スフィンゴシン、スフィンガニン、セラミド、セレブロシド及び / 又はスフィンゴミエリンである、請求項 2 に記載の剤。

【請求項 6】

前記スフィンゴ脂質がスフィンゴミエリンである、請求項 3 に記載の剤。

【請求項 7】

健康な対象の血漿及び / 又は血清におけるコレステロール及びトリグリセリドのレベルを低下させる食品又は食品サプリメントであって、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に定義されたスフィンゴ脂質又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩の高められたレベルを有する食品又は食品サプリメント。

【請求項 8】

血漿コレステロール及びトリグリセリドの高いレベルに病む対象を治療する医薬組成物であって、前記組成物は、請求項 1 に定義された式 (I) 若しくは請求項 2 に定義された式 (II) 若しくは請求項 3 に定義された式 (III) に従うスフィンゴ脂質、又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩、並びに医薬的に許容される担体、及び任意的に 1 以上の賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 9】

請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載のスフィンゴ脂質の高められた量を含む、食品。

【請求項 10】

請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載のスフィンゴ脂質の高められた量を含む、食品サプリメント。

【請求項 11】

スフィンゴ脂質が、0.01～99.9重量%の量で、より好ましくは0.05～50重量%の量で、さらにより好ましくは0.05～10重量%の量で、そして最も好ましくは0.05～5重量%の量で存在する、請求項 9 に記載の食品又は請求項 10 に記載の食品サプリメント。

【請求項 12】

前記食品又は食品サプリメントが乳製品である、請求項 9 若しくは 11 に記載の食品、又は請求項 10 若しくは 11 に記載の食品サプリメント。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

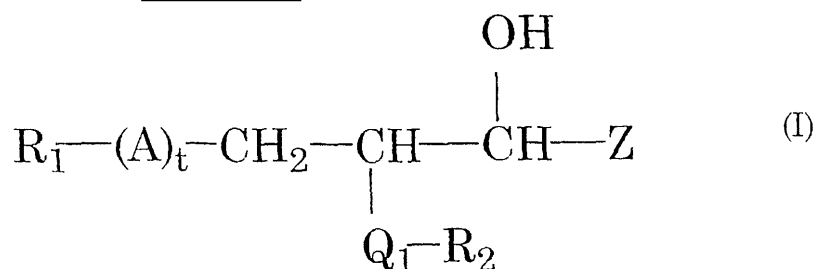
【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0018】

1 つの観点では、本発明は、対象におけるコレステロール及びトリグリセリドのレベルを減少するための剤であって、式 (I)



(ここで、

Z が、 $\text{R}_3$  又は  $-\text{CH}(\text{OH})-\text{R}_3$  であり；

A が、サルフェート、サルフォネート、フォスフェート、フォスフォネート又は  $-\text{C}(\text{O})\text{O}-$  であり；

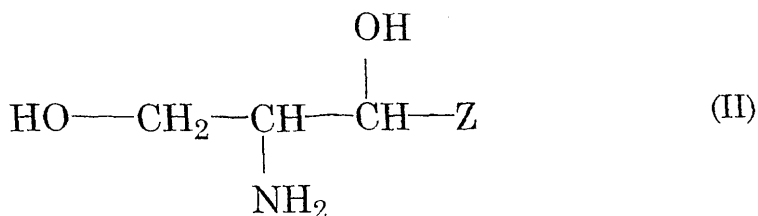
$\text{R}_1$  が、水素、水酸基、アルジトール、アルドース、アルコール、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$  アルキル又はアミノ酸残基であり；

$\text{R}_2$  が、水素、又は不飽和若しくは飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖であり；

$\text{R}_3$  が、不飽和又は飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖であり；

$\text{Q}_1$  が、第一級アミノ基 ( $-\text{NH}_2$ )、第二級アミノ基 ( $-\text{NH}-$ ) 又はアミド基 ( $-\text{NH}-\text{CO}-$ ) であり；好ましくは第二級アミノ基であり；及び

t が、0 又は 1 である) に従うスフィンゴ脂質、又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩を含む剤をいま提供する。好ましい実施態様では、該スフィンゴ脂質は、式 (II)

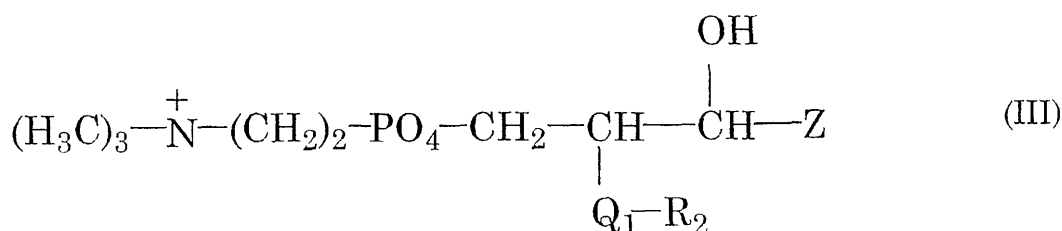


(ここで、

Z が、 $\text{R}_3$  又は  $\text{CH}(\text{OH})-\text{R}_3$  であり、及び

$\text{R}_3$  が、不飽和又は飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖である)

に従うスフィンゴ脂質であり、さらにより好ましくは、式 (III)



(ここで、

Z が、 $\text{R}_3$  又は  $\text{CH}(\text{OH})-\text{R}_3$ 、好ましくは  $\text{R}_3$  であり、及び  $\text{R}_3$  が、不飽和又は飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖であり、好ましくは  $\text{R}_3$  が、不飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖であり；

$\text{Q}_1$  が、第一級アミノ基 ( $-\text{NH}_2$ )、第二級アミノ基 ( $-\text{NH}-$ ) 又はアミド基 ( $-\text{NH}-\text{CO}-$ )、好ましくはアミノ基であり；

$\text{R}_2$  が、水素、又は不飽和若しくは飽和 ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_{30}$ ) アルキル鎖である；

) に従うスフィンゴ脂質である。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0022】

他の観点では、本発明は、健康な対象の血漿及び / 又は血清におけるコレステロール及びトリグリセリドのレベルを低下させる 食品又は食品サプリメントであって、式 (I)、(II) 若しくは (III) に従うスフィンゴ脂質、又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩の高められたレベルを有する食品又は食品サプリメントを提供する。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0023】

さらに他の観点では、本発明は、血漿コレステロール及びトリグリセリドの高いレベルに病む対象を治療する 医薬組成物であって、前記組成物は、式 (I)、(II) 若しくは (III) に従うスフィンゴ脂質、又はそれらの前駆体、誘導体若しくは医薬的に許容される塩、並びに医薬的に許容される担体、及び任意的に 1 以上の賦形剤を含む医薬組成物を提供す

る。