

【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24年6月7日(2012.6.7)

【公表番号】特表2010-530371(P2010-530371A)

【公表日】平成22年9月9日(2010.9.9)

【年通号数】公開・登録公報2010-036

【出願番号】特願2010-512322(P2010-512322)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/57	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/57
A 6 1 P	25/28
A 6 1 P	9/10
A 6 1 P	25/08
A 6 1 P	25/16
A 6 1 K	45/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年5月25日(2011.5.25)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0010

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0010】

本明細書において、パーキンソン病およびアルツハイマー病のようなニューロパチーに関係した神経障害の、神経損傷の、または神経学的な加齢に関係した衰えもしくは障害の治療あるいは予防のための組成物と、その製造および使用方法とが説明される。1つの実施形態において、組成物は、3-ヒドロキシ-5-プレグナン-20-オン(アロプレグナノロン、THP、またはAPとも呼称する)、その誘導体、類似体もしくはプロドラッグ、またはその薬学的に許容される塩を含む。THPの適切な類似体または誘導体は、3-ヒドロキシ-5-プレグナン-20-オンの3ベータ-フェニルエチニル誘導体と、3-ヒドロキシ-5-プレグナン-20-オンと実質的に同等の神経亢進作用を示す3-ヒドロキシ-5-プレグナン-20-オンの諸分子の類似体もしくは誘導体と、プロゲステロンと、プロゲステロンの天然代謝産物もしくはプロゲステロンの合成バリエントのいずれか一方で、3-ヒドロキシ-5-プレグナン-20-オンと実質的に同等の神経亢進作用を示すプロゲステロン様の諸分子とを含むがこれらに限定されない。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

個体の脳内のベータアミロイドの発現を低減する方法であって、

該方法は、3-ヒドロキシ-5-プレグナン-20-オンまたはその誘導体もしくは類似体を含む組成物を該個体に投与する工程を含み、

該組成物が、該脳内のベータアミロイドの発現を低減するのに効果的な量の3-ヒド

ロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オンまたはその誘導体もしくは類似体を提供する方法。  
。

(項目2)

前記投与の期間が約1カ月以上である項目1に記載の方法。

(項目3)

前記投与の期間が約6カ月以上である項目2に記載の方法。

(項目4)

前記投与の期間が約1年以上である項目2に記載の方法。

(項目5)

前記組成物中の前記3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オンまたはその誘導体もしくは類似体の量が、約0.1～約1000mg、好ましくは約0.1～約500mg、より好ましくは約0.1～約100mgである項目1に記載の方法。

(項目6)

前記ベータアミロイドの発現がアルツハイマー病に関連している項目1に記載の方法。

(項目7)

作用物質が注射によって、注入によって、移植によって、吸入によって、経口的にまたは局所的に投与される項目1に記載の方法。

(項目8)

3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体と、

薬学的に許容される担体と、

を含む、個体のベータ - アミロイドの発現を低減する医薬組成物であって、該組成物が、それを必要とする個体のベータ - アミロイドの発現を低減するのに効果的な量の - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体を提供する医薬組成物。

(項目9)

前記組成物内に含まれる神経増強物質の量が約0.1～約1000mg、好ましくは約0.1～約500mg、より好ましくは約0.1～約100mgである項目8に記載の医薬組成物。

(項目10)

前記組成物が、腸内投与、非経口投与、または局所投与用に調合される項目8に記載の医薬組成物。

(項目11)

前記組成物が即時放出組成物である項目8に記載の医薬組成物。

(項目12)

前記組成物が放出調節組成物である項目8に記載の医薬組成物。

(項目13)

前記組成物が徐放性放出、遅延放出、パルス放出、またはこれらの組み合わせを提供する項目8に記載の医薬組成物。

(項目14)

神経変性疾患または障害に罹っている個体の学習障害および/または記憶障害を回復させる方法であって、

該方法は、3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体を含む組成物を該個体に投与する工程を含み、

該組成物が該学習障害および/または該記憶障害を回復させるのに効果的な量の3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体を放出する方法。

(項目15)

前記障害がアルツハイマー病に関連している項目14に記載の方法。

(項目16)

前記組成物内に含まれる前記神経増強物質の量が約0.1～約1000mg、好ましくは約0.1～約500mg、より好ましくは約0.1～約100mgである項目14に記載の方法。

(項目17)

前記組成物が、腸内投与、非経口投与、または局所投与用に調合される項目14に記載の方法。

(項目18)

前記組成物が即時放出組成物である項目14に記載の方法。

(項目19)

前記組成物が放出調節組成物である項目14に記載の方法。

(項目20)

前記組成物が徐放性放出、遅延放出、パルス放出、またはこれらの組み合わせを提供する項目19に記載の方法。

(項目21)

3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体と、

薬学的に許容される担体と、

を含む、神経変性疾患または障害に罹っている個体の学習障害および/または記憶障害を回復させる医薬組成物であって、

該組成物が該学習障害および/または該記憶障害を回復させるのに効果的な量の - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体を提供する医薬組成物。

(項目22)

前記組成物内に含まれる前記神経増強物質の量が約0.1～約1000mg、好ましくは約0.1～約500mg、より好ましくは約0.1～約100mgである項目21に記載の医薬組成物。

(項目23)

前記組成物が、腸内投与、非経口投与、または局所投与用に調合される項目21に記載の医薬組成物。

(項目24)

前記組成物が即時放出組成物である項目21に記載の医薬組成物。

(項目25)

前記組成物が放出調節組成物である項目21に記載の医薬組成物。

(項目26)

前記組成物が徐放性放出、遅延放出、パルス放出、またはこれらの組み合わせを提供する項目25に記載の医薬組成物。

## 【手続補正2】

【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】

個体の脳内のベータアミロイドの発現を低減するための組成物であって、

3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オンまたはその誘導体もしくは類似体を含み、

該組成物が、該脳内のベータアミロイドの発現を低減するのに効果的な量の3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オンまたはその誘導体もしくは類似体を提供する、組成物。

**【請求項 2】**

前記組成物の投与の期間が約1ヶ月以上である請求項1に記載の組成物。

**【請求項 3】**

前記組成物の投与の期間が約6ヶ月以上である請求項2に記載の組成物。

**【請求項 4】**

前記組成物の投与の期間が約1年以上である請求項2に記載の組成物。

**【請求項 5】**

前記組成物中の前記3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オンまたはその誘導体もしくは類似体の量が、約0.1～約1000mg、好ましくは約0.1～約500mg、より好ましくは約0.1～約100mgである請求項1に記載の組成物。

**【請求項 6】**

前記ベータアミロイドの発現がアルツハイマー病に関連している請求項1に記載の組成物。

**【請求項 7】**

注射によって、注入によって、移植によって、吸入によって、経口的にまたは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 8】**

3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体と、

薬学的に許容される担体と、

を含む、個体のベータ - アミロイドの発現を低減するための医薬組成物であって、該組成物が、該低減を必要とする個体のベータ - アミロイドの発現を低減するのに効果的な量の - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体を提供する医薬組成物。

**【請求項 9】**

前記組成物内に含まれる神経増強物質の量が約0.1～約1000mg、好ましくは約0.1～約500mg、より好ましくは約0.1～約100mgである請求項8に記載の医薬組成物。

**【請求項 10】**

前記組成物が、腸内投与、非経口投与、または局所投与用に調合される請求項8に記載の医薬組成物。

**【請求項 11】**

前記組成物が即時放出組成物である請求項8に記載の医薬組成物。

**【請求項 12】**

前記組成物が放出調節組成物である請求項8に記載の医薬組成物。

**【請求項 13】**

前記組成物が徐放性放出、遅延放出、パルス放出、またはこれらの組み合わせを提供する請求項8に記載の医薬組成物。

**【請求項 14】**

神経変性疾患または障害に罹っている個体の学習障害および／または記憶障害を回復させるための組成物であって、

3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体を含み、

該組成物が該学習障害および／または該記憶障害を回復させるのに効果的な量の3 - ヒドロキシ - 5 - プレグナン - 20 - オン、またはその類似体もしくは誘導体を放出する組成物。

**【請求項 15】**

前記障害がアルツハイマー病に関連している請求項14に記載の組成物。

**【請求項 16】**

前記組成物内に含まれる神経増強物質の量が約0.1～約1000mg、好ましくは約

0.1～約500mg、より好ましくは約0.1～約100mgである請求項14に記載の組成物。

【請求項17】

前記組成物が、腸内投与、非経口投与、または局所投与用に調合される請求項14に記載の組成物。

【請求項18】

前記組成物が即時放出組成物である請求項14に記載の組成物。

【請求項19】

前記組成物が放出調節組成物である請求項14に記載の組成物。

【請求項20】

前記組成物が徐放性放出、遅延放出、パルス放出、またはこれらの組み合わせを提供する請求項19に記載の組成物。