

【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27年10月29日(2015.10.29)

【公表番号】特表2015-501787(P2015-501787A)

【公表日】平成27年1月19日(2015.1.19)

【年通号数】公開・登録公報2015-004

【出願番号】特願2014-540198(P2014-540198)

【国際特許分類】

C 0 7 J 71/00 (2006.01)

A 6 1 K 36/81 (2006.01)

A 6 1 K 36/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/585 (2006.01)

C 0 7 J 75/00 (2006.01)

A 2 3 L 1/30 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 J 71/00 C S P

A 6 1 K 35/78 R

A 6 1 K 35/78 X

A 6 1 K 35/78 Y

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 K 31/585

C 0 7 J 75/00

A 2 3 L 1/30 B

【手続補正書】

【提出日】平成27年9月4日(2015.9.4)

【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

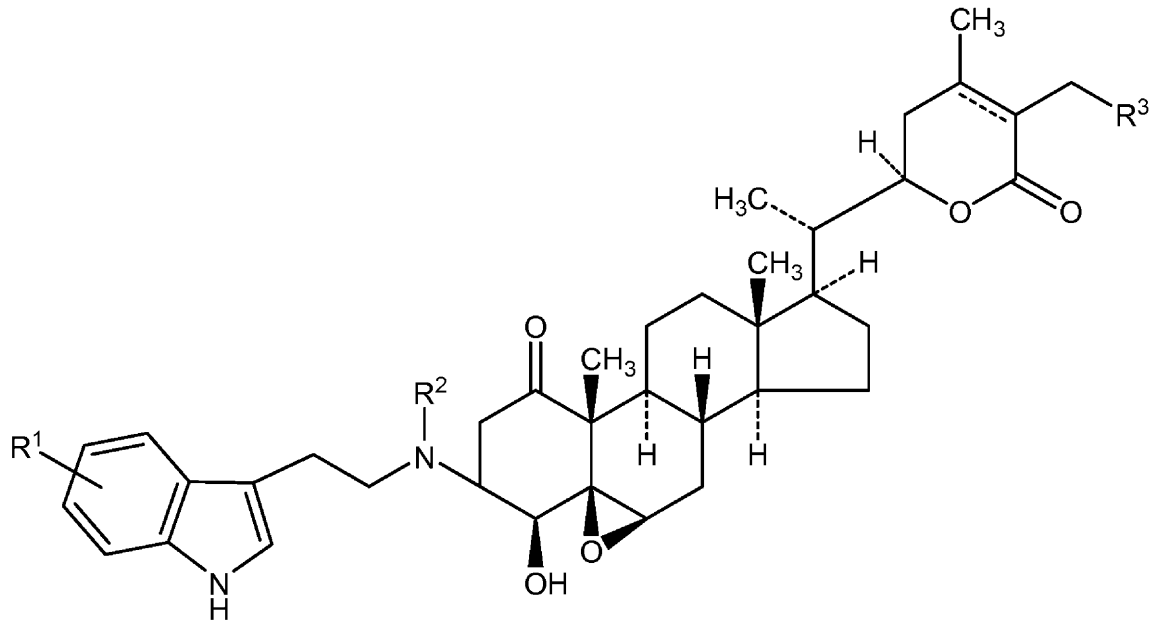
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：



(I)

の化合物またはその塩において、

式中、R¹が、水素、(C₁~C₃)-アルキル、ヒドロキシル、および(C₁~C₄)-アルコキシからなる群から選択され；

式中、R²が、水素または(C₁~C₃)-アルキルであり；

式中、R³が、水素またはヒドロキシルであり；そして

式中、

が、単結合または二重結合を表す

ことを特徴とする式(I)の化合物またはその塩。

【請求項2】

請求項1に記載の式(I)の化合物において、R¹が5-メトキシであり、R²が水素であり、R³がヒドロキシルであり、そして

が炭素-炭素二重結合である

ことを特徴とする式(I)の化合物。

【請求項3】

請求項1に記載の式(I)の化合物において、R¹が水素であり、R²が水素であり、R³がヒドロキシルであり、そして

が炭素-炭素二重結合である

ことを特徴とする式(I)の化合物。

【請求項4】

請求項1に記載の式(I)の少なくとも1種の化合物を、WS抽出物の総重量に基づき約0.2重量%~約2.5重量%の量で含むことを特徴とするウイタニア・ソムニフェラ(Withania somnifera)(WS)抽出物組成物。

【請求項5】

請求項4に記載のWS抽出物組成物において、1種または複数種のウイタノリドを、W

S抽出物の総重量に基づき約7.0重量%～約10重量%の量でさらに含むことを特徴とするWS抽出物組成物。

【請求項6】

請求項4に記載の抽出物と薬学的に受容可能なキャリアとを含むことを特徴とする薬学的組成物または機能性食品組成物。

【請求項7】

請求項1に記載の化合物と薬学的に受容可能なキャリアとを含むことを特徴とする薬学的組成物または機能性食品組成物。

【請求項8】

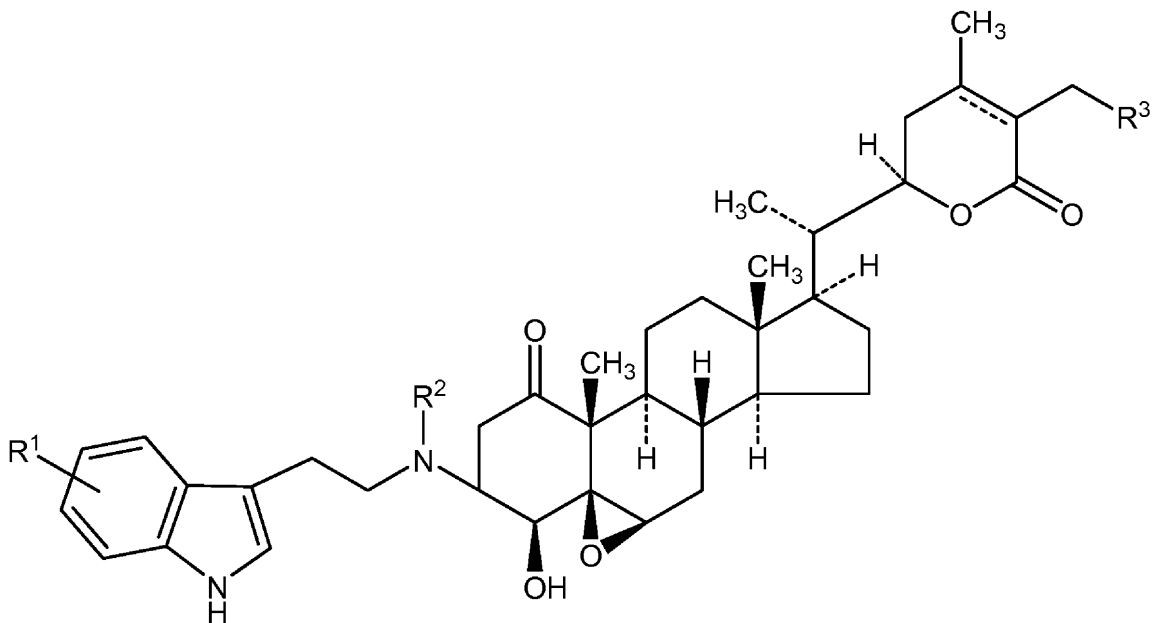
ウイタニア・ソムニフェラ (*Withania somnifera*) (WS) 抽出物を製造する方法において、

(a) ウイタニア・ソムニフェラ (*Withania somnifera*) (WS) 植物の部分を供給するステップと、

(b) 前記WS植物部分を粉砕して粉末を供給するステップと、

(c) 水を用いて前記WS粉末を抽出してWS水抽出物を供給するステップと、

(d) 前記WS水抽出物を乾燥させて、式(I)：



(I)

【式中、R¹は、水素、(C₁～C₃)-アルキル、ヒドロキシル、および(C₁～C₄)-アルコキシからなる群から選択され；

式中、R²は、水素または(C₁～C₃)-アルキルであり；

式中、R³は、水素またはヒドロキシルであり；そして

式中、

は、単結合または二重結合を表す]

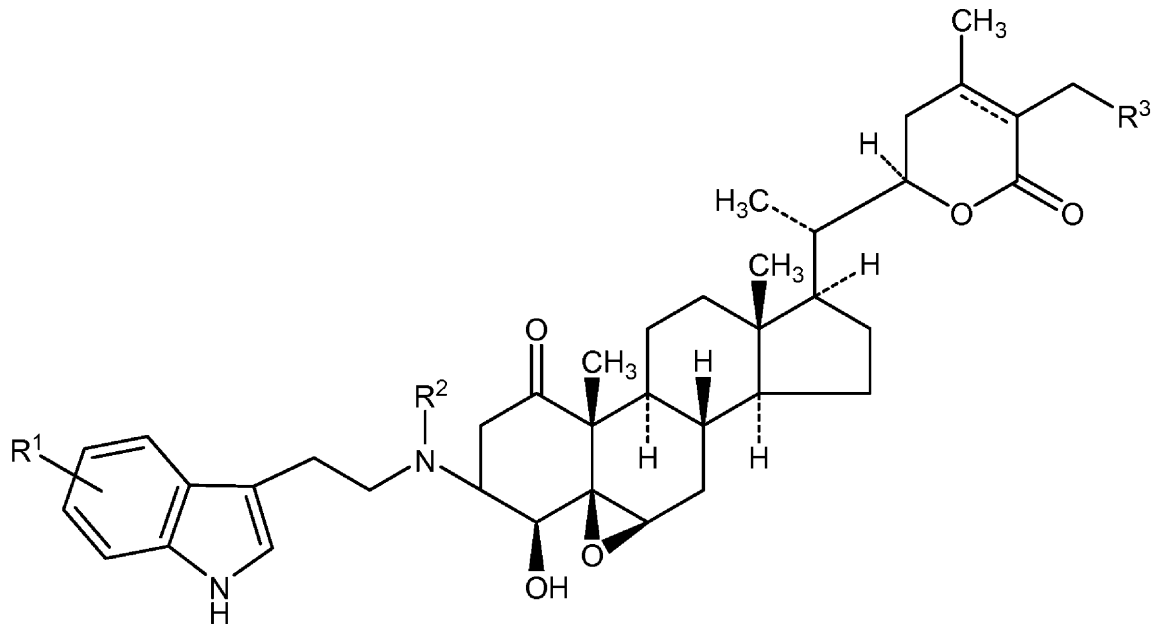
の少なくとも1種の化合物またはその塩を含有するWS抽出物粉末を供給するステップとを含み、前記少なくとも1種の化合物が、WS抽出物の総重量に基づき約0.2重量%～約1.6重量%の量で存在することを特徴とする方法。

【請求項9】

請求項8に記載の方法において、前記抽出ステップが、約3時間の時間にわたり約80にて実施されることを特徴とする方法。

【請求項10】

式 (I) :



(I)

[式中、R¹ は、水素、(C₁ ~ C₃) - アルキル、ヒドロキシル、および (C₁ ~ C₄) - アルコキシからなる群から選択され；

式中、R² は、水素または (C₁ ~ C₃) - アルキルであり；

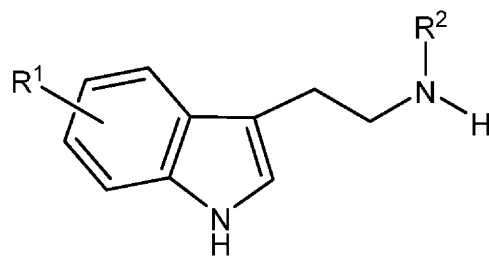
式中、R³ は、水素またはヒドロキシルであり；そして

式中、

は、単結合または二重結合を表す]

の化合物またはその塩を製造する方法において、

(a) 式 (2)

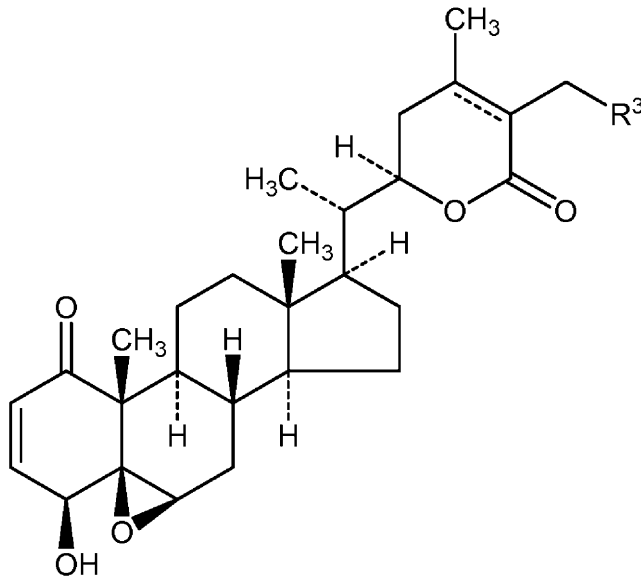


(2)

[式中、R¹ は、水素、(C₁ ~ C₃) - アルキル、ヒドロキシル、および (C₁ ~ C₄) - アルコキシからなる群から選択され；そして式中、R² は、水素または (C₁ ~ C₃) - アルキルである]

を有するトリプタミン化合物およびその塩を供給するステップと、

(b) トリプタミン化合物 (2) の溶液を塩基の存在下においてウィタノリド誘導体 (1 - a) :



(1-a)

[式中、 R^3 は、水素またはヒドロキシルであり；そして式中、

は、単結合または二重結合を表す]

に添加して反応混合物を供給するステップと、

(c) 任意選択で、結果として生じた反応混合物を加熱するステップと、

(d) 前記反応生成物から前記式 (I) の化合物またはその塩を単離するステップとを含むことを特徴とする方法。

【請求項 1 1】

請求項 1 0 に記載の方法において、ステップ (b) の後に、約 pH 6.8 ~ 7.8 の中性アルミナを前記反応混合物に添加するステップをさらに含むことを特徴とする方法。

【請求項 1 2】

請求項 1 1 に記載の方法において、化合物 (2) と化合物 (1-a) とのモル比が、約 1 : 2 であることを特徴とする方法。

【請求項 1 3】

請求項 1 1 に記載の方法において、化合物 (2) および化合物 (1-a) と中性アルミナとの質量比が、約 1 : 10 であることを特徴とする方法。

【請求項 1 4】

個体における認知症関連障害を処置または予防する組成物において、治療有効量の請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩を含むことを特徴とする組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 4 に記載の組成物において、前記化合物が、アセチルコリンエステラーゼ活性を阻害するのに有効であることを特徴とする組成物。

【請求項 1 6】

請求項 1 4 に記載の組成物において、前記認知症関連障害が、アルツハイマー病であることを特徴とする組成物。

【請求項 1 7】

個体における不安障害または抑鬱性障害を処置または予防する組成物において、治療有効量の請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩を含むことを特徴とする組成物。

【請求項 1 8】

請求項 1 7 に記載の組成物において、前記化合物が、アセチルコリンエステラーゼ活性

を阻害するのに有効であることを特徴とする組成物。