

【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25年7月11日(2013.7.11)

【公表番号】特表2012-527484(P2012-527484A)

【公表日】平成24年11月8日(2012.11.8)

【年通号数】公開・登録公報2012-046

【出願番号】特願2012-512075(P2012-512075)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/138	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/06	(2006.01)
A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/70	(2006.01)
A 6 1 K	9/127	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/138
A 6 1 K	47/04
A 6 1 K	47/18
A 6 1 K	47/14
A 6 1 K	47/10
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	47/24
A 6 1 P	25/08
A 6 1 P	25/28
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	25/18
A 6 1 P	31/04
A 6 1 P	31/10
A 6 1 P	31/12
A 6 1 P	19/10

A 6 1 P 15/08
A 6 1 P 9/00
A 6 1 K 9/08
A 6 1 K 9/10
A 6 1 K 9/06
A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 9/48
A 6 1 K 9/70 4 0 1
A 6 1 K 9/127

【手続補正書】

【提出日】平成25年5月20日(2013.5.20)

【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】

対象の神経変性障害または精神障害の治療として使用される薬剤の製造における、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物の使用。

【請求項2】

対象の神経変性障害または精神障害に対する素因の治療として使用される薬剤の製造における、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物の使用。

【請求項3】

精神障害が双極性障害である、請求項1または請求項2に記載の使用。

【請求項4】

神経変性障害が、多発性硬化症、統合失調症、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンティングトン病、筋萎縮性側索硬化症およびてんかんからなる群から選択される、請求項1または請求項2に記載の使用。

【請求項5】

骨粗鬆症、骨関節炎および心血管疾患からなる群から選択される症状の対象における治療として使用される薬剤の製造における、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物の使用。

【請求項6】

対象の不妊治療として使用される薬剤の製造における、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物の使用。

【請求項7】

対象の感染症の治療として使用される薬剤の製造における、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物の使用。

【請求項8】

前記感染症が、細菌感染症、真菌感染症、リーシュマニア感染症およびウイルス感染症からなる群から選択される、請求項7に記載の組成物の使用。

【請求項9】

前記エンドキシフェンを含む組成物が、含水アルコール性ゲル、含水アルコール性溶液、パッチ、クリーム剤、乳剤、ローション剤、軟膏剤、散剤、錠剤、カプセル剤、腸溶被覆カプセル剤、腸溶被覆錠、トローチまたはオイル中で製剤化される、請求項1から8の

いずれかに記載の使用。

【請求項 10】

前記エンドキシフェンを含む組成物が、浸透促進剤、水性ビヒクル、アルコール性ビヒクルおよびゲル化剤を含有する含水アルコール性組成物中で製剤化される、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の使用。

【請求項 11】

前記含水アルコール性組成物が中和剤を含み、前記中和剤が、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化アンモニウム、アミノメチルプロパノール、アルギニン、トロラミンおよびトロメタミンからなる群から選択され、前記中和剤が約 1 : 1 から約 4 : 1 の中和剤 / ゲル化剤の比で存在する、請求項 10 に記載の使用。

【請求項 12】

前記含水アルコール性組成物が、

(i) 約 0.01 から 0.20 重量 % のエンドキシフェンの精製された合成調製物

(ii) 約 0.1 から 2.0 重量 %、好ましくは約 0.5 から 2.0 重量 % のミリスチン酸イソプロピル

(iii) 約 50.0 から 80.0 重量 %、好ましくは約 60.0 から 75.0 重量 % のアルコール

(iv) 約 20.0 から 60.0 重量 %、好ましくは約 25.0 から 50.0 重量 % の水性ビヒクル、および

(v) 約 1.0 から 10.0 重量 %、好ましくは約 0.5 から 5.0 重量 % のゲル化剤を含み、成分の百分比は組成物の重量に対する重量である、請求項 10 に記載の使用。

【請求項 13】

前記組成物におけるエンドキシフェンの精製された合成調製物が主に、Z 異性体、E 異性体、ならびに Z 異性体および E 異性体の混合物からなる群から選択される形態である、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の使用。

【請求項 14】

前記エンドキシフェンの精製された合成調製物が、クエン酸塩、酢酸塩、ギ酸塩、シウ酸塩、コハク酸塩、酒石酸塩、トリフルオロ酢酸塩、メタンスルホン酸塩、リン酸塩、硫酸塩、塩化物、臭化物、ヨウ化物、乳酸塩、およびギ酸塩からなる塩の群から選択される塩の形態である、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の使用。

【請求項 15】

前記エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む組成物が、卵ホスファチジルコリン (EPC)、卵ホスファチジルグリセロール (EPC)、大豆ホスファチジルコリン (SPC)、水素化大豆ホスファチジルコリン (HSPC)、ジミリストイルホスファチジルコリン (DMPC)、ジミリストイルホスファチジルグリセロール (DMPG)、ジパルミトイールホスファチジルコリン (DPPC)、ジステアロイルホスファチジルグリセロール (DSPG)、ジパルミトイールホスファチジルグリセロール (DMPG)、コレステロール (Chol)、硫酸コレステリルおよびその塩 (CS)、ヘミコハク酸コレステリルおよびその塩 (Chems)、リン酸コレステリルおよびその塩 (CP)、コレステリルホスホコリンおよび他のヒドロキシコレステロール、または、アミノコレステロール誘導体、コハク酸コレステリル、オレイン酸コレステリル、コレステロール (コレステロール - PEG)、コプロスタノール、コレスタノール、コレスタン、コール酸、コルチゾール、コルチコステロン、ヒドロコルチゾン、およびカルシフェロールのポリエチレングリコール誘導体、E ググルステロン、Z ググルステロン、E および Z ググルステロンの混合物、モノグリセリド、ジグリセリド、トリグリセリド、ガラクトリピド、マンノリピド、ガラクトレシチン、-シトステロール、スチグマステロール、スチグマスタノール、ラノステロール、-スピナステロール、ラトステロール、カンペステロール、ホスファチジルコリン、ホスファチジルグリセロール、ホスファチジルエタノールアミン、ホスファチジルセリン、ホスファチジルイノシトール、ホスファチジン酸からなる群から選択される炭水化物系脂質、およびジステアロイルホスファチジルグリセロール、ジパルミトイ

ホスファチジルグリセロール、ジミリストイルホスファチジルグリセロール、およびジオレオイルホスファチジルグリセロールのペグ化誘導体からなる群から選択される脂質の少なくとも1種を含む、請求項1から8のいずれかに記載の使用。

【請求項16】

エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む前記組成物が、粉末、溶液、乳濁液、ミセル、リボソーム、脂質粒子、ゲル、ペースト形態、凍結乾燥形態、および錠剤または充填されたカプセルからなる群から選択される形態を含み、前記錠剤または充填されたカプセルが、場合によって腸溶被覆材料を含む、請求項1から8のいずれかに記載の使用。

【請求項17】

前記組成物が凍結防止剤を含む凍結乾燥形態にあり、前記凍結防止剤が、トレハロース、マルトース、ラクトース、スクロース、グルコースおよびデキストランからなる群から選択される1種または複数の糖を含む、請求項1から8のいずれかに記載の使用。

【請求項18】

対象の神経変性障害または精神障害の治療として使用される、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物。

【請求項19】

対象の神経変性障害または精神障害に対する素因の治療として使用される、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物。

【請求項20】

精神疾患が双極性障害である、請求項18または請求項19に記載の組成物。

【請求項21】

神経変性障害が、多発性硬化症、統合失調症、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンティングトン病、筋萎縮性側索硬化症およびてんかんからなる群から選択される、請求項18または請求項19に記載の組成物。

【請求項22】

骨粗鬆症、骨関節炎および心血管疾患からなる群から選択される症状の対象における治療において使用される、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物。

【請求項23】

患者の不妊治療において使用される、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物。

【請求項24】

対象の感染症の治療に使用される、エンドキシフェンまたはその薬学的に許容される塩の精製された合成調製物を含む組成物。

【請求項25】

前記感染症が、細菌感染症、真菌感染症、リーシュマニア感染症およびウイルス感染症からなる群から選択される、請求項24に記載の組成物。

【請求項26】

エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む前記組成物が、含水アルコール性ゲル、含水アルコール性溶液、パッチ、クリーム剤、乳剤、ローション剤、軟膏剤、散剤、錠剤、カプセル、腸溶被覆カプセル、腸溶被覆錠、トローチまたはオイル中で製剤化される、請求項18から25のいずれかに記載の組成物。

【請求項27】

エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む前記組成物が、浸透促進剤、水性ビヒクル、アルコール性ビヒクルおよびゲル化剤を含有する含水アルコール性組成物中で製剤化される、請求項18から25のいずれかに記載の組成物。

【請求項28】

前記含水アルコール性組成物が中和剤を含み、前記中和剤が、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化アンモニウム、アミノメチルプロパノール、アルギニン、トロラミンおよびトロメタミンからなる群から選択され、前記中和剤が中和剤／ゲル化剤約1:1か

ら約4:1の比で存在する、請求項27に記載の組成物。

【請求項29】

前記含水アルコール性組成物が、

(i) 約0.01重量%から0.20重量%のエンドキシフェン

(ii) 約0.1重量%から2.0重量%、好ましくは約0.5重量%から2.0重量%のミリスチン酸イソプロピル

(iii) 約50.0重量%から80.0重量%、好ましくは約60.0重量%から75.0重量%のアルコール

(iv) 約20.0重量%から60.0重量%、好ましくは約25.0重量%から50.0重量%の水性ビヒクル、および

(v) 約1.0重量%から10.0重量%、好ましくは約0.5重量%から5.0重量%のゲル化剤

を含み、成分の百分比が組成物の重量に対する重量である、請求項27に記載の組成物。

【請求項30】

エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む前記組成物が主に、Z異性体、E異性体、ならびにZ異性体およびE異性体の混合物からなる群から選択される形態である、請求項18から25のいずれかに記載の組成物。

【請求項31】

エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む前記組成物が、クエン酸塩、酢酸塩、ギ酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、酒石酸塩、トリフルオロ酢酸塩、メタンスルホン酸塩、リン酸塩、硫酸塩、塩化物、臭化物、ヨウ化物、乳酸塩、およびギ酸塩からなる塩の群から選択される塩の形態である、請求項18から25のいずれかに記載の組成物。

【請求項32】

エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む前記組成物が、卵ホスファチジルコリン(EPC)、卵ホスファチジルグリセロール(EPG)、大豆ホスファチジルコリン(SPC)、水素化大豆ホスファチジルコリン(HSPC)、ジミリストイルホスファチジルコリン(DMPC)、ジミリストイルホスファチジルグリセロール(DMPG)、ジパルミトイールホスファチジルコリン(DPPC)、ジステアロイルホスファチジルグリセロール(DSPG)、ジパルミトイールホスファチジルグリセロール(DMPG)、コレステロール(Chol)、硫酸コレステリルおよびその塩(CS)、ヘミコハク酸コレステリルおよびその塩(Chems)、リン酸コレステリルおよびその塩(CP)、コレステリルホスホコリンおよび他のヒドロキシコレステロールまたはアミノコレステロール誘導体、コハク酸コレステリル、オレイン酸コレステリル、コレステロール(コレステロール-P EG)、コプロスタノール、コレスタノール、コレスタン、コール酸、コルチゾール、コルチコステロン、ヒドロコルチゾン、およびカルシフェロールのポリエチレングリコール誘導体、Eググルステロン、Zググルステロン、EおよびZググルステロンの混合物、モノグリセリド、ジグリセリド、トリグリセリド、ガラクトリピド、マンノリピド、ガラクトレシチン、-シトステロール、スチグマステロール、スチグマスタノール、ラノステロール、-スピナステロール、ラトステロール、カンペステロール、ホスファチジルコリン、ホスファチジルグリセロール、ホスファチジルエタノールアミン、ホスファチジルセリン、ホスファチジルイノシトール、ホスファチジン酸からなる群から選択される炭水化物系脂質、およびジステアロイルホスファチジルグリセロール、ジパルミトイールホスファチジルグリセロール、ジミリストイルホスファチジルグリセロール、およびジオレオイルホスファチジルグリセロールのペグ化誘導体からなる群から選択される脂質の少なくとも1種を含む、請求項18から25に記載の組成物。

【請求項33】

エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む前記組成物が、粉末、溶液、エマルジョン、ミセル、リポソーム、脂質粒子、ゲル、ペースト形態、凍結乾燥形態、および錠剤または充填されたカプセルからなる群から選択される形態を含み、前記錠剤または充填されたカプセルが、場合により腸溶被覆材料を含む、請求項18から25のいずれかに記載

の組成物。

【請求項 3 4】

エンドキシフェンの精製された合成調製物を含む前記組成物が凍結防止剤を含む凍結乾燥形態であり、前記凍結防止剤が、トレハロース、マルトース、ラクトース、スクロース、グルコースおよびデキストランからなる群から選択される 1 種または複数の糖を含む、請求項 1 8 から 2 5 のいずれかに記載の組成物。