

【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4月5日(2007.4.5)

【公表番号】特表2006-518743(P2006-518743A)

【公表日】平成18年8月17日(2006.8.17)

【年通号数】公開・登録公報2006-032

【出願番号】特願2006-503721(P2006-503721)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/133 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/19 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/133

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 9/19

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 9/107

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 47/26

【手続補正書】

【提出日】平成19年2月14日(2007.2.14)

【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】

(a) スフィンゴ脂質と、

(b) 乳酸と、

(c) 必要に応じて安定剤と

から実質的になり、乳酸のスフィンゴ脂質に対するモル比が1:1から10:1である安定な水溶液。

【請求項2】

前記スフィンゴ脂質が、スフィンゴシン、ジヒドロスフィンゴシン、D-トレオ-ジヒドロスフィンゴシン、L-トレオ-ジヒドロスフィンゴシンまたはサフィンゴール、DL-トレオ-ジヒドロスフィンゴシン、リゾスフィンゴ脂質、それらの組み合わせ、およびそれらの薬学的に許容される塩からなる群より選択される請求項1に記載の溶液。

【請求項3】

前記スフィンゴ脂質が、L-トレオ-ジヒドロスフィンゴシン(「サフィンゴール」)である請求項2に記載の溶液。

【請求項4】

前記スフィンゴ脂質が、約 0.1 ~ 約 30 mg / ml の量で前記溶液中に含まれる請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 5】

安定剤をさらに含む請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 6】

前記安定剤が、アルコールまたはポリヒドロキシアアルコールである請求項 5 に記載の溶液。

【請求項 7】

前記アルコールが、エタノールである請求項 6 に記載の溶液。

【請求項 8】

前記ポリヒドロキシアアルコールが、マンニトールである請求項 6 に記載の溶液。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の溶液を凍結乾燥する方法によって製造される再構成可能な組成物。

【請求項 10】

乳酸中で安定化されたサフィンゴールを含む溶液であって、乳酸の L - トレオ - ジヒドロスフィンゴシンまたはサフィンゴールに対するモル比が約 3.5 : 1 から約 4 : 1 であり、サフィンゴールが約 2.5 ~ 約 5.0 mg / ml の量で存在し、前記溶液が、約 20 mg / ml の量のエタノール、または約 5 mg / ml の量のマンニトールをさらに含む溶液。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の溶液を凍結乾燥する方法によって製造される再構成可能な組成物。

【請求項 12】

乳酸中のスフィンゴ脂質の安定化された溶液を製造する方法であって、

(a) 前記スフィンゴ脂質を希薄乳酸溶液中に溶解させるステップであって、前記スフィンゴ脂質が約 0.1 ~ 約 30 mg / ml 溶液の量で存在するステップと、

(b) (a) で得られた生成物に安定剤を加えるステップと、

(c) (c) で得られた生成物を必要に応じて凍結乾燥するステップとを含む方法。

【請求項 13】

癌の治療のための医薬を製造するための、請求項 1 に記載の溶液の使用。

【請求項 14】

前記スフィンゴ脂質が、スフィンゴシン、ジヒドロスフィンゴシン、D - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、L - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、DL - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、リゾスフィンゴ脂質、それらの組み合わせ、およびそれらの薬学的に許容される塩からなる群より選択される請求項 13 に記載の溶液の使用。

【請求項 15】

前記癌が、白血病、リンパ腫、神経芽細胞腫、肺癌、皮膚癌、前立腺癌、大腸癌、乳癌、卵巣癌、子宮頸癌、脳癌、および膀胱癌からなる群より選択される請求項 13 に記載の溶液の使用。

【請求項 16】

前記溶液が、経口的または非経口的に投与される請求項 13 に記載の溶液の使用。

【請求項 17】

前記溶液が、非経口的に投与される請求項 13 に記載の溶液の使用。

【請求項 18】

前記溶液が、静脈内に投与される請求項 13 に記載の溶液の使用。

【請求項 19】

前記被験対象が、ヒトまたは動物被験対象である請求項 13 に記載の溶液の使用。

【請求項 20】

(a) 乳酸と、

(b) 約 0.1 ~ 約 30 mg / ml 溶液の量で存在するスフィンゴ脂質と、

(c) 必要に応じて等張剤と、

(d) 約 0.2 ~ 約 200 mg / ml エマルジョンの量で存在するリン脂質とから実質的になるエマルジョン製剤。

【請求項 21】

前記スフィンゴ脂質が、スフィンゴシン、ジヒドロスフィンゴシン、D - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、L - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、DL - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、リゾスフィンゴ脂質、それらの組み合わせ、およびそれらの薬学的に許容される塩からなる群より選択される請求項 20 に記載のエマルジョン。

【請求項 22】

前記スフィンゴ脂質が、L - トレオ - ジヒドロスフィンゴシンまたはサフィンゴールである請求項 21 に記載のエマルジョン。

【請求項 23】

前記水性媒体が、水である請求項 20 に記載のエマルジョン。

【請求項 24】

乳酸のスフィンゴ脂質に対するモル比が約 1 から約 10 : 1 である請求項 20 に記載のエマルジョン。

【請求項 25】

前記等張剤が、グルコースである請求項 20 に記載のエマルジョン。

【請求項 26】

前記リン脂質が、ホスファチジルコリン、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、ホスファチジイルノシトール、ホスファチジルグリセロール、ホスファチジン酸、リゾリン脂質、卵リン脂質、大豆リン脂質、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される請求項 20 に記載のエマルジョン。

【請求項 27】

前記エマルジョンの平均粒径が、約 0.03 μ m 未満である請求項 20 に記載のエマルジョン。

【請求項 28】

前記エマルジョンが、約 2 ~ 約 8 の温度において少なくとも 6 か月の貯蔵寿命を有する請求項 20 に記載のエマルジョン。

【請求項 29】

水性媒体中で安定化されたスフィンゴ脂質を含むエマルジョンの製造方法であって、
(a) 前記スフィンゴ脂質を希薄乳酸溶液中に溶解させるステップであって、前記スフィンゴ脂質が約 0.1 ~ 約 30 mg / ml 溶液の量で存在するステップと、
(b) 必要に応じて等張剤を加えるステップと、
(c) 前記エマルジョンを形成するために、(a) または (b) で得られた生成物にリン脂質を加えるステップと
を含むエマルジョンの製造方法。

【請求項 30】

癌の治療のための医薬を製造するための、請求項 20 に記載のエマルジョンの使用。

【請求項 31】

前記スフィンゴ脂質が、スフィンゴシン、ジヒドロスフィンゴシン、D - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、L - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、DL - トレオ - ジヒドロスフィンゴシン、リゾスフィンゴ脂質、それらの組み合わせ、およびそれらの薬学的に許容される塩からなる群より選択される請求項 29 に記載の方法。

【請求項 32】

前記リン脂質が、ホスファチジルコリン、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、ホスファチジイルノシトール、ホスファチジルグリセロール、ホスファチジン酸、リゾリン脂質、卵リン脂質、大豆リン脂質、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される請求項 29 に記載の方法。

【請求項 33】

前記癌が、白血病、リンパ腫、神経芽細胞腫、肺癌、皮膚癌、前立腺癌、大腸癌、乳癌

、卵巣癌、子宮頸癌、脳癌、および膀胱癌からなる群より選択される請求項 3 0 に記載のエマルジョンの使用。

【請求項 3 4】

前記エマルジョンが、経口的または非経口的に投与される請求項 3 0 に記載のエマルジョンの使用。

【請求項 3 5】

前記エマルジョンが、非経口的に投与される請求項 3 0 に記載のエマルジョンの使用。

【請求項 3 6】

前記エマルジョンが、静脈内に投与される請求項 3 0 に記載のエマルジョンの使用。

【請求項 3 7】

前記被験対象が、ヒトまたは動物被験対象である請求項 3 0 に記載のエマルジョンの使用。