

【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】令和1年6月27日(2019.6.27)

【公表番号】特表2018-517736(P2018-517736A)

【公表日】平成30年7月5日(2018.7.5)

【年通号数】公開・登録公報2018-025

【出願番号】特願2017-565134(P2017-565134)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/127	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/44	(2017.01)
A 6 1 K	31/192	(2006.01)
A 6 1 K	31/196	(2006.01)
A 6 1 K	31/5415	(2006.01)
A 6 1 K	31/415	(2006.01)
A 6 1 K	31/365	(2006.01)
A 6 1 K	47/28	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00
A 6 1 P	29/00
A 6 1 K	9/127
A 6 1 K	47/24
A 6 1 K	47/44
A 6 1 K	31/192
A 6 1 K	31/196
A 6 1 K	31/5415
A 6 1 K	31/415
A 6 1 K	31/365
A 6 1 K	47/28

【手続補正書】

【提出日】令和1年5月17日(2019.5.17)

【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】

非コクリエート化NSAIDに対する忍容性が低いか、又は胃腸管内のNSAID誘導性病変若しくは潰瘍に罹りやすい被検体を治療するための、コクリエートを含む配合物であって、該コクリエートが治療有効量のNSAIDを含み、経口投与される配合物。

【請求項2】

前記コクリエートが、
負に帯電したリン脂質を含む脂質単分子層であって、該脂質単分子層が疎水性ドメインを取り囲み、前記NSAIDが該疎水性ドメイン内に分散している、脂質単分子層と、
交互二価カチオンと、前記負に帯電したリン脂質を含むリン脂質二重層とを含む脂質層

であって、前記脂質単分子層が該脂質層内に隔離されている、脂質層と、を含むジオードコクリエートである、請求項1に記載の配合物。

【請求項3】

前記疎水性ドメインが油である、請求項2に記載の配合物。

【請求項4】

前記N S A I D がサリチラート、プロピオン酸誘導体、酢酸誘導体、エノール酸(-オキシカム)誘導体、アントラニル酸誘導体、選択的COX-2阻害剤、及びスルホンアニドからなる群から選択される、請求項1～3のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項5】

前記治療有効量のN S A I D を含むコクリエートが、投与した場合に、胃腸管内でいかなる病変も誘導しない、請求項1～4のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項6】

前記ジオードコクリエートが、被験体の胃腸管内に病変又は潰瘍が発生する被験体の割合を、前記N S A I D の非コクリエート化型により治療した場合に胃腸管内に病変又は潰瘍が発生する被験体の割合と比較して40%、50%、60%、70%、80%、90%又は100%超低減する、請求項1～5のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項7】

前記ジオードコクリエートが、被験体の胃腸管内の病変又は潰瘍の平均数を、前記N S A I D の非コクリエート化型と比較して60%、70%、80%、90%又は100%超低減する、請求項1～6のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項8】

前記ジオードコクリエートが、被験体の胃腸管内の病変又は潰瘍の平均サイズを、前記N S A I D の非コクリエート化型と比較して50%、60%、70%、80%、90%又は100%超低減する、請求項1～7のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項9】

前記ジオードコクリエート中のN S A I D 用量が、同じN S A I D の非コクリエート化型の用量と比較して20%、30%、40%、50%、60%、70%、80%又は90%超低減されている、請求項1～8のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項10】

前記被験体が非コクリエート化N S A I D に対する忍容性が低い、請求項1～9のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項11】

前記被験体が胃腸管内のN S A I D 誘導性病変又は潰瘍に罹りやすい、請求項1～10のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項12】

疎水性ドメイン(H D)とジオードコクリエートのリン脂質成分(P P L G D)との比率H D : P P L G D、又はヒマシ油ドメイン(C O D)とジオードコクリエートのリン脂質成分(P P L G D)との比率C O D : P P L G Dが1:20以下、1:15以下、1:10以下、1:8以下、1:6以下、1:5以下、1:4以下、1:3.5以下、1:3以下、1:2.75以下、1:2.5以下、1:2.25以下、1:2以下、1:1.75以下、1:1.5以下、1:1.25以下、1:1以下である、請求項2～11のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項13】

前記コクリエートの1日当たりの用量が3g、2.5g、2g、1.5g、1.25g、1g、750mg、500mg、400mg、300mg、250mg、200mg、150mg、100mg又は50mg以下である、請求項1～12のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項14】

前記コクリエートが1日1回又は1日2回投与される、請求項1～13のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項 1 5】

前記配合物が胆汁酸塩を更に含む、請求項1～14のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項 1 6】

前記コクリエート配合物が0.1 mM～0.5 mMの胆汁酸塩を含有する、請求項1 5に記載の配合物。

【請求項 1 7】

前記被験体がヒトである、請求項1～16のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項 1 8】

前記コクリエートが1つ以上の負に帯電した脂質を含み、該1つ以上の負に帯電した脂質が該コクリエート中の全脂質の40%～70%を占める、請求項1～17のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項 1 9】

前記1つ以上の負に帯電した脂質が前記コクリエート中の全脂質の50%～60%を占める、請求項1 8に記載の配合物。

【請求項 2 0】

前記1つ以上の負に帯電した脂質がホスファチジルセリンを含む、請求項1 9に記載の配合物。

【請求項 2 1】

前記ホスファチジルセリンがダイズホスファチジルセリンである、請求項2 0に記載の配合物。

【請求項 2 2】

前記コクリエートが1つ以上の中性又はカチオン性の脂質又はステロールを更に含む、請求項1～21のいずれか一項に記載の配合物。

【請求項 2 3】

前記1つ以上の中性又はカチオン性の脂質又はステロールが、ホスファチジルコリン及びスフィンゴミエリンからなる群から選択される、請求項2 2に記載の配合物。