

【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28年8月12日(2016.8.12)

【公表番号】特表2015-520241(P2015-520241A)

【公表日】平成27年7月16日(2015.7.16)

【年通号数】公開・登録公報2015-045

【出願番号】特願2015-518599(P2015-518599)

【国際特許分類】

|         |        |           |
|---------|--------|-----------|
| A 6 1 K | 31/404 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/14   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/34  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 45/00  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/02  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 29/00  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/06  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/00  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/28  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/10   | (2006.01) |

【F I】

|         |        |       |
|---------|--------|-------|
| A 6 1 K | 31/404 |       |
| A 6 1 K | 9/14   |       |
| A 6 1 K | 47/34  |       |
| A 6 1 K | 45/00  |       |
| A 6 1 P | 43/00  | 1 2 1 |
| A 6 1 P | 35/00  |       |
| A 6 1 P | 35/02  |       |
| A 6 1 P | 29/00  |       |
| A 6 1 P | 17/06  |       |
| A 6 1 P | 25/00  |       |
| A 6 1 P | 25/28  |       |
| A 6 1 K | 9/10   |       |
| A 6 1 P | 43/00  | 1 1 1 |

【手続補正書】

【提出日】平成28年6月20日(2016.6.20)

【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】

(a) インジルビン粒子が2ミクロン未満の有効平均粒子径を有するインジルビンまたはその誘導体の粒子；および

(b) 少なくとも1つの表面安定剤

を含むものであるナノ微粒子インジルビン組成物。

【請求項2】

ナノ微粒子インジルビン粒子の有効平均粒子径が1000nm未満である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

ナノ微粒子インジルビン粒子の有効平均粒子径が500nm未満である、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

インジルビン粒子の少なくとも70%が有効平均粒子径未満の粒子径を有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

組成物が経口または静脈内投与用に製剤されている、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

組成物が1以上の中成薬上許容される賦形剤、担体、またはそれらの組み合わせをさらに含むものである、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

他の賦形剤を含まない、インジルビンと少なくとも1つの表面安定剤の総組み合わせ乾重量に基づいて、インジルビンが80重量%～99.9999重量%存在する、請求項1に記載の組成物。

【請求項8】

他の賦形剤を含まない、インジルビンと少なくとも1つの表面安定剤の総組み合わせ乾重量に基づいて、少なくとも1つの表面安定剤が0.0001重量%～20重量%の量で存在する、請求項1に記載の組成物。

【請求項9】

少なくとも2つの表面安定剤を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項10】

表面安定剤が陰イオン表面安定剤、陽イオン表面安定剤、双性イオン表面安定剤、および非イオン表面安定剤からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項11】

少なくとも1つの表面安定剤がポロキサマーである、請求項1に記載の組成物。

【請求項12】

ポロキサマーがエチレンオキシドとプロピレンオキシドのブロックコポリマーからなる群より選択される、請求項11に記載の組成物。

【請求項13】

ポロキサマーがエチレンオキシドのブロックコポリマーである、請求項11に記載の組成物。

【請求項14】

2ミクロン超の有効平均粒子径を有するインジルビン組成物をさらに含むものである、請求項1に記載の組成物。

【請求項15】

2ミクロン未満の有効平均粒子径を有する少なくとも1つの追加のナノ微粒子インジルビン組成物をさらに含み、ここで前記追加のナノ微粒子インジルビン組成物は請求項1に記載のナノ微粒子インジルビン組成物の有効平均粒子径と異なる有効平均粒子径を有するものである、請求項1に記載の組成物。

【請求項16】

少なくとも1つの非インジルビン活性薬をさらに含むものである、請求項1に記載の組成物。

【請求項17】

投与剤形が0.1(1/s)のせん断速度にて2000mPas未満の粘度を有する液体投与剤形に製剤されている、請求項1に記載の組成物。

【請求項18】

投与すると組成物は再分散し、インジルビン粒子が2ミクロン未満の有効平均粒子径を

有するようになる、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 19】

組成物は生物関連媒質中で再分散し、インジルビン粒子が2ミクロン未満の有効平均粒子径を有するようになる、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 19 のいずれか1項のナノ微粒子インジルビン組成物を作製する方法であって、インジルビン粒子を少なくとも 1 つの表面安定剤と 2 ミクロン未満の有効平均粒子径を有するナノ微粒子インジルビン組成物を与えるのに十分な時間および条件のもとで接触させるステップを含むものである前記方法。

【請求項 21】

前記接触させるステップが粉碎するステップを含むものである、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 22】

前記粉碎するステップが湿式粉碎するステップを含むものである、請求項 21 に記載の方法。

【請求項 23】

前記接触させるステップが均質化および乳濁化するステップを含むものである、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 24】

前記接触するステップが

- (a) インジルビン粒子を溶媒に溶解するステップ；
- (b) 得られるインジルビン溶液を少なくとも 1 つの表面安定剤を含む溶液に加えるステップ、ならびに
- (c) 可溶化したインジルビンと少なくとも 1 つの表面安定剤を沈降させるステップを含むものである、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 25】

請求項 1 ~ 19 のいずれか1項に記載のナノ微粒子インジルビン組成物を含む、癌を治療するための医薬組成物。

【請求項 26】

請求項 1 ~ 19 のいずれか1項に記載のナノ微粒子インジルビン組成物を含む、炎症性疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項 27】

請求項 1 ~ 19 のいずれか1項に記載のナノ微粒子インジルビン組成物を含む、神経変性障害を治療するための医薬組成物。