

【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26年11月20日 (2014.11.20)

【公表番号】特表2013-545752(P2013-545752A)

【公表日】平成25年12月26日 (2013.12.26)

【年通号数】公開・登録公報2013-069

【出願番号】特願2013-538998(P2013-538998)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/352 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 39/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/352

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/44

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 39/00

【手続補正書】

【提出日】平成26年10月2日 (2014.10.2)

【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】

ナノ粒子状ゲニステインと、  
懸濁媒体を形成する 1 種または複数の薬学的に許容される賦形剤と  
を含むゲニステイン製剤であって、ナノ粒子状ゲニステインが 0.5  $\mu$ m 以下の D (0.50) を示し、1 種または複数の薬学的に許容される賦形剤がナノ粒子状ゲニステインが懸濁媒体中に懸濁されるように選択される、製剤。

【請求項 2】

ナノ粒子状ゲニステインが 0.2  $\mu$ m 以下の D (0.50) を示す、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 3】

ナノ粒子状ゲニステインが 0.2  $\mu$ m 以下の D (0.50) および 0.5  $\mu$ m 以下の D

( 0 . 9 0 ) を示す、請求項 2 に記載の製剤。

【請求項 4】

ナノ粒子状ゲニステインが 0 . 2  $\mu$  m 以下の D ( 0 . 5 0 ) および 0 . 4  $\mu$  m 以下の D ( 0 . 9 0 ) を示す、請求項 2 に記載の製剤。

【請求項 5】

1 種または複数の薬学的に許容される賦形剤が、非イオン性界面活性剤、水溶性ポリマー、希釈剤および緩衝液の少なくとも 1 つを含む、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 6】

1 種または複数の薬学的に許容される賦形剤が非イオン性界面活性剤および水溶性ポリマーを含む、請求項 5 に記載の製剤。

【請求項 7】

非イオン性界面活性剤がポリソルベート 8 0 およびポリソルベート 2 0 の少なくとも 1 つである、請求項 6 に記載の製剤。

【請求項 8】

非イオン性界面活性剤が 0 . 0 1 重量 % から 1 0 重量 % ( w / w ) の範囲の量で存在する、請求項 6 に記載の製剤。

【請求項 9】

非イオン性界面活性剤が 0 . 1 % から 1 0 % ( w / w ) の範囲の量で存在する、請求項 8 に記載の製剤。

【請求項 1 0】

存在する非イオン性界面活性剤の量が、 0 . 2 % から 5 % ( w / w ) 、 0 . 2 % から 1 % ( w / w ) 、 0 . 2 % から 1 % ( w / w ) 、 0 . 2 % から 0 . 6 % ( w / w ) および 0 . 2 % から 0 . 8 % から選択される、請求項 9 に記載の製剤。

【請求項 1 1】

水溶性ポリマーが P V P である、請求項 6 から 1 0 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 1 2】

P V P がポビドン K 1 7 である、請求項 6 から 1 1 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 1 3】

水溶性ポリマーが 0 . 5 % から 1 5 % ( w / w ) の範囲の量で存在する、請求項 6 から 1 2 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 1 4】

水溶性ポリマーが 1 % から 1 0 % ( w / w ) の範囲の量で存在する、請求項 6 から 1 3 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 1 5】

存在する水溶性ポリマーの量が、 5 % から 1 5 % ( w / w ) 、 1 0 % から 1 5 % ( w / w ) 、 1 2 % から 1 5 % ( w / w ) 、 1 % から 8 % ( w / w ) および 1 % から 5 % ( w / w ) から選択される、請求項 6 から 1 4 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 1 6】

非イオン性界面活性剤の量が、 0 . 0 1 % から 1 0 % ( w / w ) 、 0 . 1 % から 1 0 % ( w / w ) 、 0 . 2 % から 5 % ( w / w ) 、 0 . 2 % から 1 % ( w / w ) 、 0 . 2 % から 1 % ( w / w ) 、 0 . 2 % から 0 . 6 % ( w / w ) および 0 . 2 % から 0 . 8 % ( w / w ) から選択され、水溶性ポリマーの量が、 0 . 5 % から 1 5 % ( w / w ) 、 1 % から 1 0 % ( w / w ) 、 5 % から 1 5 % ( w / w ) 、 1 0 % から 1 5 % ( w / w ) 、 1 2 % から 1 5 % ( w / w ) 、 1 % から 8 % ( w / w ) および 1 % から 5 % ( w / w ) から選択される、請求項 6 に記載の製剤。

【請求項 1 7】

非イオン性界面活性剤が 0 . 1 % から 1 % ( w / w ) の範囲の量で存在し、水溶性ポリマーが 1 % から 1 5 % ( w / w ) の範囲の量で存在する、請求項 1 6 に記載の製剤。

【請求項 1 8】

非イオン性界面活性剤が 0.2% から 1% (w/w) の範囲の量で存在し、水溶性ポリマーが 5% から 15% (w/w) の範囲の量で存在する、請求項 16 に記載の製剤。

【請求項 19】

ゲニステインが  $250 \text{ mg / ml}$  以上の濃度で製剤中に存在する、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 20】

ゲニステインが少なくとも  $300 \text{ mg / ml}$  の濃度で製剤中に存在する、請求項 1 から 19 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 21】

ゲニステインが、 $250 \text{ mg / ml}$  から  $500 \text{ mg / ml}$  の間の濃度、 $200 \text{ mg / ml}$  から  $400 \text{ mg / ml}$  の間の濃度、 $250 \text{ mg / ml}$  から  $350 \text{ mg / ml}$  の間の濃度および  $275 \text{ mg / ml}$  から  $325 \text{ mg / ml}$  の間の濃度から選択される濃度で製剤中に存在する、請求項 1 から 20 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 22】

緩衝液および希釈剤の少なくとも 1 種をさらに含む、請求項 1 から 21 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 23】

緩衝液がリン酸ナトリウム緩衝液である、請求項 22 に記載の製剤。

【請求項 24】

希釈剤が塩化ナトリウム溶液である、請求項 22 または請求項 23 に記載の製剤。

【請求項 25】

2 から 12 の範囲の pH、4 から 8 の範囲の pH、5 から 7 の範囲の pH から選択される pH を示す、請求項 22 から 24 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 26】

PEG 400、PEG 300、綿実油およびヒマシ油のうちの少なくとも 1 種から選択される薬学的に許容される賦形剤をさらに含む、請求項 1 から 25 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 27】

ゲニステインを薬学的に許容される懸濁媒体と合わせるステップと、  
合わされたゲニステインおよび薬学的に許容される懸濁媒体をナノ粉碎して、 $0.5 \mu\text{m}$  以下の D (0.50) を特徴とする粒径分布を示す、ナノ粒子状ゲニステインを含有するナノ懸濁液を形成するステップと  
を含む、ゲニステイン製剤の製造方法。

【請求項 28】

ナノ粒子状ゲニステインが  $0.2 \mu\text{m}$  以下の D (0.50) を示す、請求項 27 に記載の方法。

【請求項 29】

ナノ粒子状ゲニステインが  $0.2 \mu\text{m}$  以下の D (0.50) および  $0.5 \mu\text{m}$  以下の D (0.90) を示す、請求項 27 または請求項 28 に記載の方法。

【請求項 30】

ナノ粒子状ゲニステインが  $0.2 \mu\text{m}$  以下の D (0.50) および  $0.4 \mu\text{m}$  以下の D (0.90) を示す、請求項 27 から 29 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 31】

薬学的に許容される懸濁媒体が、非イオン性界面活性剤および水溶性ポリマーを含む、請求項 27 から 30 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 32】

非イオン性界面活性剤がポリソルベート 80 およびポリソルベート 20 の少なくとも 1 つである、請求項 31 に記載の方法。

【請求項 33】

非イオン性界面活性剤が 0.01% から 10% (w/w) の範囲の量で存在する、請求

項 3 1 または請求項 3 2 に記載の方法。

【請求項 3 4】

水溶性ポリマーが P V P である、請求項 3 1 から 3 3 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 5】

水溶性ポリマーがポビドン K 1 7 である、請求項 3 1 から 3 4 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 6】

水溶性ポリマーが 0 . 5 % から 1 5 % ( w / w ) の範囲の量で存在する、請求項 3 1 から 3 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 7】

薬学的に許容される懸濁媒体が緩衝希釈液をさらに含む、請求項 2 7 から 3 6 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 8】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、乳房、結腸、前立腺、甲状腺および頭頸部の癌から選択される癌の発生、発症または進行を阻止するための医薬組成物であって、ゲニステイン製剤の投与が癌の発生、発症または進行を阻止する、医薬組成物。

【請求項 3 9】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、非ホジキンリンパ腫、黒色腫、肺癌および卵巣癌から選択される癌の発症または進行を阻止するための医薬組成物であって、ゲニステイン製剤の投与が癌の発症または進行を阻止する、医薬組成物。

【請求項 4 0】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、嚢胞性線維症の発症または進行を阻止するための医薬組成物であって、ゲニステイン製剤の投与が対象における嚢胞性線維症の発症または進行を阻止する、医薬組成物。

【請求項 4 1】

嚢胞性線維症のリスクがあるまたはそれを患っている対象が D e l t a F 5 0 8 - C F T R を内因的に産生し、さらに、ゲニステイン製剤の投与が対象内での D e l t a F 5 0 8 - C F T R の崩壊を阻止する、請求項 4 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 2】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、閉経後骨量減少を低減させるための医薬組成物であって、ゲニステイン製剤の投与が対象における骨量減少の発現または進行を阻止する、医薬組成物。

【請求項 4 3】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、骨形成を促進するための医薬組成物であって、ゲニステイン製剤の投与が対象における骨形成を促進する、医薬組成物。

【請求項 4 4】

ゲニステイン製剤の投与が対象の脊椎における骨形成を促進する、請求項 4 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、L D L コレステロールを制御するための医薬組成物であって、ゲニステイン製剤の投与が対象における循環 L D L のレベルを低下させる、医薬組成物。

【請求項 4 6】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、H D L コレステロールのレベルを増加させるための医薬組成物であって、ゲニステイン製剤の投与が対象における循環 H D L のレベルを増加させる、医薬組成物。

【請求項 4 7】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、急性の放射線症候群を処置するための医薬組成物。

【請求項 4 8】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、急性の放射線症候群を予防的に処置するための医薬組成物であって、ゲニステイン製剤の治療有効量が放射線への曝露の前に対象に投与される、医薬組成物。

【請求項 4 9】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、急性の放射線症候群を処置するための医薬組成物であって、

対象が放射線への曝露を受ける場合には、対象が放射線曝露を受けた後に、ゲニステイン製剤の治療有効量を対象に投与し続ける、医薬組成物。

【請求項 5 0】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、治療手段または診断手段の一部としての放射線への曝露を受けた対象を処置するための医薬組成物。

【請求項 5 1】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載のゲニステイン製剤の治療有効量を含む、治療手段または診断手段の一部としての放射線への曝露を受ける対象を処置するための医薬組成物であって、

ゲニステイン製剤の治療有効量が治療手段または診断手段を受ける前に対象に投与され、ゲニステイン製剤の治療有効量が治療手段または診断手段を受けた後に対象に投与し続けられる、医薬組成物。