

【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 23 年 9 月 29 日 (2011.9.29)

【公表番号】特表 2010-536718 (P2010-536718A)

【公表日】平成 22 年 12 月 2 日 (2010.12.2)

【年通号数】公開・登録公報 2010-048

【出願番号】特願 2010-520393 (P2010-520393)

【国際特許分類】

A 6 1 K 36/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 35/78 C

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成 23 年 8 月 10 日 (2011.8.10)

【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】

薬剤における活性成分としてのピペル・クベバ (Piper cubeba L.) の果実の乾燥抽出物の製造方法であり、

- エッセンシャルオイルの除去用の第 1 ステップにて、ピペル・クベバ (Piper cubeba L.) の果実を、

- 水蒸気蒸留にさらし、留出物を除去する、または

- 親油性相で少なくとも 1 回抽出し、この親油性抽出物もしくはこれらの親油性抽出物を除去する、

- 第 2 ステップにて、処理をした該果実を、少なくとも 1 つのアルコールまたは少なくとも 1 つのアルコールと水の混合液のいずれかで少なくとも 1 回抽出する、および

- 第 3 ステップにて、抽出された果実部分を除去し、得られた該抽出物を助剤の添加後に 0.1 ~ 10 m / m % の間のアルコール濃度まで最初に濃縮してスピッサム (spissum)

抽出物とし、次いで乾燥させて得られること、

を特徴とする製造方法。

【請求項 2】

ピペル・クベバ (Piper cubeba L.) の未成熟果実を用い、抽出の直前に粉砕し、粉砕形態にて、特に 0.1 mm ~ 0.9 mm の粉砕粒径 (grinding fineness) を有する粉砕形態にて抽出することを特徴とする、請求項 1 の製造方法。

【請求項 3】

第 1 ステップにて、親油性相として超臨界 CO₂ または 4 ~ 9 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分枝鎖状炭化水素、特にヘキサンもしくはイソペンタンを用いることを特徴とする、請求項 1 ~ 2 のいずれか 1 項の製造方法。

【請求項 4】

第 1 ステップにて抽出される重量部あたりの果実が、親油性相の 1 ~ 20 重量部、特に 6 ~ 12 重量部にて用いられることを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項の製造方法。

【請求項 5】

第 1 ステップにて、親油性相での抽出が温度 0 ~ 50、特に 5 ~ 15 で、2 ~ 4 時間の間に実現されることを特徴とする、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項の製造方法。

【請求項 6】

第 2 ステップにて、アルコールが 1 ~ 5 個の炭素原子を有するアルコール、特にエタノールであり、少なくとも 1 つのアルコールと水の混合液が 50 ~ 90 m/m % のアルコールと 50 ~ 10 m/m % の水、好ましくは 80 ~ 90 m/m % のアルコールと 20 ~ 10 m/m % の水からなり、エタノールが好まれることを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項の製造方法。

【請求項 7】

第 2 ステップにて抽出される重量部あたりの果実が、少なくとも 1 つのアルコールまたは少なくとも 1 つのアルコールと水の混合液の 1 ~ 20 重量部、特に 6 ~ 12 重量部にて用いられることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項の製造方法。

【請求項 8】

第 2 ステップにて、少なくとも 1 つのアルコールまたは少なくとも 1 つのアルコールと水の混合液での抽出が温度 20 ~ 60 で、2 ~ 4 時間の間に実現されることを特徴とする、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項の製造方法。

【請求項 9】

第 3 ステップにて、助剤が乾燥助剤、例えばマンニトールであり、5 m/m % のアルコール濃度まで濃縮され、乾燥がスプレー乾燥、ベルト乾燥またはブレード乾燥であることを特徴とする、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項の製造方法。

【請求項 10】

第 3 ステップにて得られる抽出物が、- クベベン (cubebene) および - クベベン (cubebene) が存在しない、またはほとんど存在しないことを特徴とする、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項の製造方法。

【請求項 11】

癌疾患、特に前立腺癌、精巣癌、乳癌、子宮癌、およびこれらの転移からなる群から選択される少なくとも 1 つの疾患の治療用の薬剤の製造におけるピペル・クベバ (Piper cubeba L.) 由来の抽出物または抽出物化合物の使用であり、これらの抽出物またはこれらの抽出物化合物が抗アンドロゲンおよび / または抗エストロゲン活性を有する使用。

【請求項 12】

癌疾患、特に前立腺癌、精巣癌、乳癌、子宮癌、およびこれらの転移ならびに良性前立腺過形成からなる群から選択される少なくとも 1 つの疾患の治療用の薬剤の製造における請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項の製造方法で得られた抽出物の使用。

【請求項 13】

前立腺癌、およびその転移、ならびに良性前立腺過形成の治療用の薬剤の製造における請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項の製造方法で得られた抽出物の使用であり、この抽出物が DHT と略される性ホルモンであるジヒドロテストステロンの活性、特に前立腺癌細胞に対するその細胞増殖促進および抗アポトーシス活性と拮抗する使用。

【請求項 14】

癌疾患、特に前立腺癌、精巣癌、乳癌、子宮癌、およびこれらの転移ならびに良性前立腺過形成からなる群から選択される少なくとも 1 つの疾患の治療用の薬剤であり、活性成分としてピペル・クベバ (Piper cubeba L.) 由来の抽出物または抽出物化合物を含み、この抽出物またはこれらの抽出物化合物が抗アンドロゲンおよび / または抗エストロゲン活性を有することを特徴とする薬剤。

【請求項 15】

活性成分が請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項の製造方法で得られた抽出物に含まれることを特徴とする、請求項 14 の薬剤。

【請求項 16】

抽出物が、DHT と略される性ホルモンであるジヒドロテストステロンの活性、特に前立腺癌細胞に対するその細胞増殖促進および抗アポトーシス効果と拮抗する、前立腺癌、

およびその転移、または良性前立腺過形成の治療用の薬剤の製造用の、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項の製造方法で得られた抽出物の使用。