

【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 2 年 5 月 21 日 (2020.5.21)

【公表番号】特表 2019-510805 (P2019-510805A)

【公表日】平成 31 年 4 月 18 日 (2019.4.18)

【年通号数】公開・登録公報 2019-015

【出願番号】特願 2018-553111 (P2018-553111)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/44 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 33/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/7004 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/51 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 35/747 (2015.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 38/44

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 33/40

A 6 1 K 31/7004

A 6 1 P 1/04

A 6 1 K 9/51

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 35/747

A 6 1 P 43/00 1 2 3

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 4 月 6 日 (2020.4.6)

【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】

哺乳動物の炎症性腸疾患を治療または予防するための方法で使用するための、過酸化水素または過酸化水素発生体系を含む送達系であって、前記方法は、前記哺乳動物に前記送達系を経口投与するステップを含み、前記送達系は、経口送達のために、および哺乳動物胃腸管の標的位置において前記過酸化水素または過酸化水素発生体系を *in situ* で放出するように製剤化されている送達系。

【請求項 2】

過酸化水素または過酸化水素発生体系を含む経口投薬送達系であって、前記送達系は、哺乳動物への経口投与のために、および哺乳動物胃腸管内の標的位置において前記過酸化水素または過酸化水素発生体系を放出するように構成されており、それにより前記哺乳動物の腸の前記標的位置での過酸化水素レベルの局所的増加を達成する経口投薬送達系。

**【請求項 3】**

前記送達系は、結腸において前記過酸化水素または前記過酸化水素発生体系を *in situ* で放出するように製剤化されている、請求項 1 に記載の使用のための請求項 1 に記載の送達系、または、請求項 2 に記載の経口送達系。

**【請求項 4】**

前記過酸化水素発生体系は、前記哺乳動物胃腸管の標的位置において *in situ* で反応して、過酸化水素を産生するように構成されている酵素および基質を含み、好ましくは、前記基質はグルコースであり、前記酵素はグルコースオキシダーゼである、請求項 1 に記載の使用のための請求項 1 または 3 に記載の送達系、または、請求項 2 または 3 に記載の経口送達系。

**【請求項 5】**

前記過酸化水素発生体系は、前記胃腸管の前記標的位置での前記酵素および基質の放出前は、前記酵素および基質を別々にしておくように構成されている、請求項 1 に記載の使用のための請求項 4 に記載の送達系、または、請求項 4 に記載の経口送達系。

**【請求項 6】**

前記酵素は、第 1 の微粒子組成物として提供されており、前記基質は、第 2 の微粒子組成物として提供されており、好ましくは、前記第 1 の微粒子組成物および第 2 の微粒子組成物は各々独立して、マイクロ粒子、ミクロスフェア、ナノ粒子、および顆粒状粒子から選択される、請求項 1 に記載の使用のための請求項 5 に記載の送達系、または、請求項 5 に記載の経口送達系。

**【請求項 7】**

前記第 1 の微粒子組成物および第 2 の微粒子組成物は、前記胃腸管内の標的位置で前記組成物を放出するように構成されている容器内に含有されており、好ましくは、前記容器は、腸溶性コーティングである、請求項 1 に記載の使用のための請求項 6 に記載の送達系、または、請求項 6 に記載の経口送達系。

**【請求項 8】**

前記第 1 の微粒子組成物の粒子は、腸溶性コーティングを有し、前記第 2 の微粒子組成物の粒子は、腸溶性コーティングを有する、請求項 1 に記載の使用のための請求項 6 または 7 に記載の送達系、または、請求項 6 または 7 に記載の経口送達系。

**【請求項 9】**

前記送達系は、過酸化水素を含み、好ましくは、前記送達系は、前記胃腸管の前記標的位置において前記過酸化水素を *in situ* で遅延放出するように構成されているポリマー性マトリックスを含む、請求項 1 に記載の使用のための請求項 1 または 3 に記載の送達系、または、請求項 2 または 3 に記載の経口送達系。

**【請求項 10】**

前記過酸化水素発生体系は、哺乳動物上皮組織を局所刺激して、前記胃腸管の前記標的位置において過酸化水素を *in situ* で産生することが可能な活性作用剤を含む、請求項 1 に記載の使用のための請求項 1 または 3 に記載の送達系、または、請求項 2 または 3 に記載の経口送達系。

**【請求項 11】**

前記活性作用剤は、 $\text{NOX}1$  または  $\text{DUOX}2$  発現および / または活性を増強するアゴニストであり、好ましくは、前記  $\text{NOX}1$  アゴニストは、 $\text{Tox1}$  受容体アゴニスト、プロテインキナーゼ C 刺激因子または微生物由来の刺激、または類似のアゴニスト、または、 $\text{NOX}1$  を上方制御することが可能な作用剤から選択され、前記  $\text{DUOX}2$  アゴニストは、G タンパク質共役受容体または類似の受容体の刺激によりカルシウム放出またはカルシウム流入を誘導することが可能な作用剤、ならびに  $\text{DUOX}2$  および / または  $\text{DUOX}A2$  を上方制御することが可能な作用剤から選択される請求項 1 に記載の使用のための請求項 10 に記載の送達系、または、請求項 10 に記載の経口送達系。

**【請求項 12】**

前記過酸化水素発生体系は、過酸化水素を産生する細菌であり、好ましくは、前記細菌

は、過酸化水素を過剰発現するように遺伝子操作されているか、または過酸化水素生成酵素である、請求項 1 に記載の使用のための請求項 1 または 3 に記載の送達系、または、請求項 2 または 3 に記載の経口送達系。

【請求項 1 3】

前記送達系は、前記胃腸管の前記標的位置において  $5 \text{ nmol}$  から  $20 \text{ } \mu\text{mol}$  の過酸化水素を *in situ* で放出または生成するように構成されている、請求項 1 に記載の使用のための請求項 1 または 3 から 1 2 のいずれかに記載の送達系、または、請求項 2 ~ 1 2 のいずれかに記載の経口送達系。

【請求項 1 4】

前記炎症性腸疾患は、潰瘍性大腸炎またはクローン病である、請求項 1 に記載の使用のための請求項 1 または 3 ~ 1 3 のいずれかに記載の送達系。

【請求項 1 5】

前記送達系は、前記疾患の症状の急性再発を予防するために、前記疾患の寛解期中に投与される、請求項 1 または 1 4 に記載の使用のための請求項 1 または 3 ~ 1 3 のいずれかに記載の送達系。