

【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 1 月 30 日 (2014.1.30)

【公表番号】特表 2013-521271 (P2013-521271A)

【公表日】平成 25 年 6 月 10 日 (2013.6.10)

【年通号数】公開・登録公報 2013-029

【出願番号】特願 2012-555529 (P2012-555529)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 49/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 49/00 A

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/32

【手続補正書】

【提出日】平成 25 年 12 月 4 日 (2013.12.4)

【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】

少なくとも 1 つの生理学的に許容できる添加剤と併せて、少なくとも 1 つの色素を含有する経口投与のための固体組成物であって、

a) 融点が 90 未満の親油性化合物、および両親媒性化合物からなり、前記少なくとも 1 つの色素が少なくとも部分的に組み入れられている、マトリックスと、

b) 親水性化合物からなり、前記親油性マトリックスおよび前記両親媒性マトリックスが分散されている外部マトリックスと、

c) 任意選択で、他の生理学的に許容できる添加剤と、

d) 任意選択で、胃耐性コーティングと

を含み、

前記少なくとも 1 つの色素は、メチレンブルー、コンゴレッド、カルミンインジゴ、トリジンブルーまたはそれらの混合物の中から選択されることを特徴とする組成物。

【請求項 2】

前記少なくとも 1 つの色素は、2 mg から 1000 mg の間の範囲の量で含まれることを特徴とする請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 3】**

前記少なくとも 1 つの色素は、10 mg から 1500 mg の間の範囲の量で含まれることを特徴とする請求項 1 または 2 に記載の組成物。

**【請求項 4】**

前記少なくとも 1 つの色素は、50 mg から 1200 mg の間の範囲の量で含まれることを特徴とする請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 5】**

前記少なくとも 1 つの色素は、20 mg から 500 mg の間の範囲の量で含まれることを特徴とする請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 6】**

前記少なくとも 1 つの色素は、約 25 mg と等しい量で含まれることを特徴とする請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 7】**

前記少なくとも 1 つの色素は、約 50 mg と等しい量で含まれることを特徴とする請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 8】**

錠剤またはカプセル剤の形態であることを特徴とする請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 9】**

前記親油性化合物は、飽和、不飽和もしくは水素化長鎖アルコール、飽和、不飽和もしくは水素化脂肪酸、それらの塩、エステルもしくはアミド、脂肪酸のモノグリセリド、ジグリセリドもしくはトリグリセリド、それらのポリエトキシ化誘導体、ワックス、セラミド、コレステロール、コレステロール誘導体またはそれらの混合物の中から選択されることを特徴とする請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 10】**

前記両親媒性化合物は、I 型または II 型の極性脂質、セラミド、グリコールアルキルエーテル、アルキルサルフェートもしくはスルホサクシネート塩またはそれらの混合物の中から選択されることを特徴とする請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 11】**

前記 I 型または II 型の極性脂質は、レシチン、ホスファチジルコリン、ホスファチジルエタノールアミンまたはそれらの混合物の中から選択され、前記グリコールアルキルエーテルは、ジエチレングリコールモノメチルエーテルであることを特徴とする請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 12】**

前記親水性化合物はヒドロゲルを形成する化合物であり、好ましくはアクリル酸もしくはメタクリル酸のポリマーもしくはコポリマー、アルキルビニルポリマー、アルキルセルロース、ヒドロキシアルキルセルロース、カルボキシアルキルセルロース、修飾セルロース、多置換セルロース、多糖、デキストリン、ペクチン、デンプン、複合デンプン、デンプン誘導体、アルギン酸、合成ゴム、天然ゴム、多価アルコールまたはそれらの混合物の中から選択されることを特徴とする請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 13】**

前記胃耐性コーティングは、アクリル酸もしくはメタクリル酸のポリマー、アクリル酸もしくはメタクリル酸のコポリマー、セルロース誘導体、ヒドロキシブチレートベースのポリマー、シェラックまたはそれらの混合物の中から選択されることを特徴とする請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 14】**

診断目的のためであることを特徴とする請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 15】**

胃腸管の内視鏡診断評価における使用のためであることを特徴とする請求項 14 に記載

の組成物。

【請求項 16】

胃腸管の炎症性、潰瘍性、異形成性、前新生物性および新生物性の病変の内視鏡診断評価における使用のためであることを特徴とする請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 17】

胃腸管の癌性形態、前癌性形態、ポリープ、偽ポリープ、または異なる炎症性病変の内視鏡診断評価における使用のためであることを特徴とする請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 18】

腸の炎症性、潰瘍性、異形成性、前新生物性および新生物性の病変の内視鏡診断評価のための方法であって、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の 1 つまたは複数の固体組成物を、前記内視鏡診断評価に先立つ 24 時間以内に投与することを含むことを特徴とする方法。

【請求項 19】

前記投与は、診断評価に先立つ 24 時間以内に一度、または繰り返して、好ましくは、投与される用量を 2 つ以上の摂取に分割して、行われることを特徴とする請求項 18 に記載の方法。

【請求項 20】

胃腸管の癌性もしくは前癌性形態、ポリープ、偽ポリープまたは異なる炎症性病変の内視鏡診断評価のためであることを特徴とする請求項 18 に記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0101

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0101】

図 1 ~ 4 は、内視鏡検査に先立つ 24 時間以内に本発明の組成物を摂取した患者の内視鏡検査中に得られた 4 つの内視鏡画像を示している。画像は、他は正常であるものの患者の結腸領域の一部の区画のみがいかに着色されているかを明らかに示している。このことは、本発明の組成物の摂取後、色素が、非病的であると見なされる区画ではなく（図 1 を参照）、調べた結腸領域の病的区画のみをいかに強調するか（図 2、3 ~ 4 を参照）を示している。