

【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9月3日(2020.9.3)

【公表番号】特表2019-526542(P2019-526542A)

【公表日】令和1年9月19日(2019.9.19)

【年通号数】公開・登録公報2019-038

【出願番号】特願2019-505245(P2019-505245)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/575 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2017.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/575

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/44

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/12

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 9/10

【手続補正書】

【提出日】令和2年7月22日(2020.7.22)

【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】

1種以上の酸素化コレステロールサルフェート(OCS)、及び
少なくとも1種のポリオキシシルグリセリド
を含む組成物。

【請求項 2】

少なくとも1種のポリオキシシルグリセリドが、飽和ポリグリコール化グリセリドを含む
、請求項1に記載の組成物。

【請求項 3】

飽和ポリグリコール化グリセリドが、ラウロイルポリオキシシルグリセリド及び/又はス
テアロイルポリオキシシルグリセリドである、請求項2に記載の組成物。

【請求項 4】

少なくとも1種のポリオキシシルグリセリドが、組成物の総重量に対して、10重量%～99重
量%の範囲の量で組成物中に存在する、請求項1～3のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 5】

1種以上の酸素化コレステロールサルフェートを含む粒子を含む、請求項1～4のいずれ
か一項に記載の組成物。

【請求項 6】

1種以上の酸素化コレステロールサルフェートが、5-コレステレン-3 β ,25-ジオール,3-サ
ルフェート又はその薬学的に許容される塩を含む、請求項1～5のいずれか一項に記載の組
成物。

【請求項 7】

1種以上の酸素化コレステロールサルフェートが、組成物の重量に対して、0.5重量%～5
0重量%の範囲の量で存在する、請求項1～6のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 8】

少なくとも1種の界面活性剤をさらに含む、請求項1～7のいずれか一項に記載の組成物
。

【請求項 9】

少なくとも1種の界面活性剤が、PEG-8カプリル酸/カプリン酸グリセリド及び/又はポリ
グリセリル-3オレエートである、請求項8に記載の組成物。

【請求項 10】

少なくとも1種の界面活性剤が、組成物の重量に対して、0.01重量%～20重量%の範囲の
量で組成物中に存在する、請求項8又は9に記載の組成物。

【請求項 11】

組成物の総重量に対して、1重量%～15重量%の範囲の量で組成物中に存在する、少なく
とも1種のポリグリセリル脂肪酸エステルをさらに含む、請求項1～10のいずれか一項に記
載の組成物。

【請求項 12】

カプセル内に収容された、請求項1～11のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 13】

25HC3Sを含む粒子、
ラウロイルポリオキシシルグリセリド、及び
ステアロイルポリオキシシルグリセリド
を含む、請求項1～12のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 14】

医薬として使用するための、請求項1～13のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 15】

高脂血症又は高脂血症によって引き起こされる疾患若しくは症状;少なくとも1つの器官
の機能異常又は不全;脂質代謝障害;代謝障害;アテローム性動脈硬化症;虚血によって引き

起こされる傷害;望ましくない細胞死;敗血症;急性放射線症候群;肝障害;脂質蓄積障害;皮膚病変;及び炎症性皮膚疾患のうち少なくとも1つから選択される疾患又は症状の処置に使用するための、請求項1～13のいずれか一項に記載の組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0379

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0379】

本開示はその好ましい実施形態の点から記載されているが、当業者であれば、添付した態様及び特許請求の範囲の精神及びその範囲内において、本開示を改変して実施できることを理解するであろう。したがって、本開示は上記の実施形態に限定されるべきではなく、本明細書に示した記載内容の精神及び範囲に包含される、その全ての改変及び均等物をさらに含むべきである。

本発明は、以下の実施形態を包含する。

(実施形態1)

1種以上の酸素化コレステロールサルフェート(OCS)、及び
少なくとも1種のポリオキシグリセリド
を含む組成物。

(実施形態2)

少なくとも1種のポリオキシグリセリドが、飽和ポリグリコール化グリセリドを含む、
実施形態1に記載の組成物。

(実施形態3)

飽和ポリグリコール化グリセリドが、約38℃～約55℃の融点及び約1～約16の親水親油
バランス(HLB)を有する飽和ポリグリコール化グリセリドである、実施形態2に記載の組成
物。

(実施形態4)

飽和ポリグリコール化グリセリドが、約38℃～約50℃の融点及び約1～約16のHLBを有す
る飽和ポリグリコール化グリセリドである、実施形態2に記載の組成物。

(実施形態5)

飽和ポリグリコール化グリセリドが、ラウロイルポリオキシグリセリド及び/又はス
テアロイルポリオキシグリセリドである、実施形態2～4のいずれか一項に記載の組成物
。

(実施形態6)

少なくとも1種のポリオキシグリセリドが、組成物の総重量に対して、約10重量%～約
99重量%の範囲の量で組成物中に存在する、実施形態1～5のいずれか一項に記載の組成物
。

(実施形態7)

1種以上の酸素化コレステロールサルフェートを含む粒子を含む、実施形態1～6のいず
れか一項に記載の組成物。

(実施形態8)

ビヒクル中の粒子の懸濁液を含む、実施形態7に記載の組成物。

(実施形態9)

粒子が、レーザー回折によって測定した、約0.1 μm～約500 μmの範囲の中央粒径を有す
る、実施形態7及び8のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態10)

1種以上の酸素化コレステロールサルフェートが、5-コレステレン-3β,25-ジオール,3-サ
ルフェート又はその薬学的に許容される塩を含む、実施形態1～9のいずれか一項に記載の
組成物。

(実施形態11)

1種以上の酸素化コレステロールサルフェートが、組成物の重量に対して、約0.5重量%～約50重量%の範囲の量で存在する、実施形態1～10のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 1 2)

少なくとも1種の界面活性剤をさらに含む、実施形態1～11のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 1 3)

非イオン性界面活性剤である少なくとも1種の界面活性剤をさらに含む、実施形態1～12のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 1 4)

ポリソルベート、ソルビタンエステル、ポロキサマー、レシチンドデシル硫酸ナトリウム(SDS)、硫酸化ヒマシ油、塩化ベンザルコニウム、セトリミド、ポリオキシヒマシ油、d- α -トコフェリルポリエチレングリコール1000スクシネート(TPGS)、ポリオキシエチレンエステル、カプリル酸/カプリン酸グリセリド、ポリグリセリルオレエート、リノール酸グリセリド、ポリオキシステアレート、ハッカ油、及びオレイン酸から選択される少なくとも1種の界面活性剤をさらに含む、実施形態1～13のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 1 5)

少なくとも1種の界面活性剤が、PEG-8カプリル酸/カプリン酸グリセリド及び/又はポリグリセリル-3オレエートである、実施形態12に記載の組成物。

(実施形態 1 6)

少なくとも1種の界面活性剤が、組成物の重量に対して、約0.01重量%～約20重量%の範囲の量で組成物中に存在する、実施形態12～15のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 1 7)

少なくとも1種の界面活性剤が、組成物の重量に対して、約0.01重量%～約10重量%の範囲の量で組成物中に存在する、実施形態12～15のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 1 8)

組成物の総重量に対して、約1重量%～約15重量%の範囲の量で組成物中に存在する、少なくとも1種のポリグリセリル脂肪酸エステルをさらに含む、実施形態1～17のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 1 9)

組成物の総重量に対して、約5重量%～約15重量%の範囲の量で組成物中に存在する、少なくとも1種のポリグリセリル脂肪酸エステルをさらに含む、実施形態1～17のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 2 0)

カプセル内に収容された、実施形態1～19のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 2 1)

25HC3Sを含む粒子、
ラウロイルポリオキシグリセリド、及び
ステアロイルポリオキシグリセリド

を含む、実施形態1～20のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 2 2)

カプセル内にある、実施形態21に記載の組成物。

(実施形態 2 3)

ラウロイルポリオキシグリセリドが、組成物の重量に対して、約55重量%～約95重量%の範囲の量で組成物中に存在し、

ステアロイルポリオキシグリセリドが、組成物の重量に対して、約1重量%～約30重量%の範囲の量で組成物中に存在する、実施形態21又は22に記載の組成物。

(実施形態 2 4)

PEG-8カプリル酸/カプリン酸グリセリドを含む、実施形態21～23のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 25)

ポリグリセリル-3オレエートを含む、実施形態21～24のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 26)

PEG-8カプリル酸/カプリン酸グリセリドが、組成物の重量に対して、約1重量%～約15重量%の範囲の量で組成物中に存在する、実施形態24又は25に記載の組成物。

(実施形態 27)

ポリグリセリル-3オレエートが、組成物の重量に対して、約1重量%～約15重量%の範囲の量で組成物中に存在する、実施形態25～26のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 28)

ポリグリセリル-3オレエートが、組成物の重量に対して、約5重量%～約10重量%の範囲の量で組成物中に存在する、実施形態25～26のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 29)

それを必要とする対象において、高脂血症又は高脂血症によって引き起こされる疾患若しくは症状;少なくとも1つの器官の機能異常又は不全;脂質代謝障害;代謝障害;アテローム性動脈硬化症;虚血によって引き起こされる傷害;望ましくない細胞死;敗血症;急性放射線症候群;肝障害;脂質蓄積障害;皮膚病変;及び炎症性皮膚疾患のうち少なくとも1つを処置する方法であって、実施形態1～28のいずれか一項に記載の、治療有効量の組成物を対象に投与することを含む方法。

(実施形態 30)

投与が、経口により行われる、実施形態29に記載の方法。

(実施形態 31)

医薬として使用するための、実施形態1～28のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 32)

高脂血症又は高脂血症によって引き起こされる疾患若しくは症状;少なくとも1つの器官の機能異常又は不全;脂質代謝障害;代謝障害;アテローム性動脈硬化症;虚血によって引き起こされる傷害;望ましくない細胞死;敗血症;急性放射線症候群;肝障害;脂質蓄積障害;皮膚病変;及び炎症性皮膚疾患のうち少なくとも1つから選択される疾患又は症状の処置に使用するための、実施形態1～28のいずれか一項に記載の組成物。

(実施形態 33)

高脂血症又は高脂血症によって引き起こされる疾患若しくは症状;少なくとも1つの器官の機能異常又は不全;脂質代謝障害;代謝障害;アテローム性動脈硬化症;虚血によって引き起こされる傷害;望ましくない細胞死;敗血症;急性放射線症候群;肝障害;脂質蓄積障害;皮膚病変;及び炎症性皮膚疾患のうち少なくとも1つから選択される疾患又は症状の処置に使用するための医薬の製造における、実施形態1～28のいずれか一項に記載の組成物の使用