

【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11月4日(2011.11.4)

【公表番号】特表2011-507812(P2011-507812A)

【公表日】平成23年3月10日(2011.3.10)

【年通号数】公開・登録公報2011-010

【出願番号】特願2010-538335(P2010-538335)

【国際特許分類】

A 6 1 K 36/28 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 31/352 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 39/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 K 36/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 35/78 T

A 6 1 K 31/357

A 6 1 K 31/352

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 43/00 1 0 7

A 6 1 P 39/02

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/14

A 6 1 K 35/78 Y

【手続補正書】

【提出日】平成23年9月12日(2011.9.12)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 2 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 4】

したがって、本発明は、さらに、80%以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法に関し、ここで15～85重量%、特に30～65重量%のシリマリン含有量を有する抽出物を無水アルコール中に溶解し、必要に応じて濾過し、濃縮し、次いで乾燥させ、必要に応じて粉碎する。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

80%以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法であって、15～85重量%、特に、30～65重量%のシリマリンを含有する抽出物を無水アルコール中に溶解し、必要に応じて濾過し、濃縮し、次いで乾燥させ、必要に応じて粉碎することを特徴とする、方法。

(項目2)

80%以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法であって、

(a) 植物性薬剤を、中程度の極性を有する溶媒（例えば、必要に応じて水性画分を含有する、酢酸エチル、エタノール、アセトン、メタノール）を用いて、好ましくは 40 ～ 80 、特に好ましくは 50 ～ 70 で抽出する工程、

(b) 分離し、好ましくは濾過する工程、

(c) 60 未満、好ましくは 40 未満の温度で、好ましくは真空下で攪拌して濃縮する工程、および (c ') 必要に応じて温水で洗浄する工程、

(d) エタノール、好ましくは 96 % 以上のエタノール、または同様の極性の溶媒と混合し、次いで、ヘキサンまたは同様の極性の溶媒と混合し、好ましくは 1 ～ 100 m b a r の圧力で濃縮し、生じたエタノール - 水相を除去する工程、

(e) 乾燥させ、必要に応じて粉砕する工程、

(f) 無水アルコール中、好ましくはエタノール中に溶解する工程、

(g) 必要に応じて濾過し、濃縮する工程、ならびに

(h) 乾燥させ、必要に応じて粉砕する工程

を特徴とする、方法。

(項目 3)

工程 (a) において、前記中程度の極性の溶媒は、酢酸エチル、エタノール、およびメタノールからなる群より選択され、好ましくは酢酸エチルであることを特徴とする、項目 2 に記載の 80 % 以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法。

(項目 4)

工程 (f) において、前記無水アルコールは無水 C 1 - C 4 アルコールであることを特徴とする、項目 2 に記載の 80 % 以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法。

(項目 5)

項目 1 から項目 4 のいずれか一項に記載の方法によって得ることができるミルクシスル果実抽出物。

(項目 6)

本質的に非晶質の結晶変性物から成るミルクシスル果実抽出物。

(項目 7)

非晶質の結晶変性物から成るミルクシスル果実抽出物であって、その結晶画分が 20 % 未満、特に 10 % 未満、好ましくは 7 % 未満である、ミルクシスル果実抽出物。

(項目 8)

肝臓および胆嚢の機能不全、特に、毒性の肝障害（脂肪肝、アルコール）、キノコ中毒などの肝臓症、急性肝不全、肝臓の壊死、肝栄養障害症、肝硬変、肝線維症、肝腫、および脂肪肝変性、肝不全、ならびに、肝炎、特に C 型肝炎の処置および予防のための、項目 5 から項目 7 のいずれか一項に記載のミルクシスル果実抽出物。

(項目 9)

項目 8 に記載のミルクシスル果実抽出物を含有する医薬調製物。

【手続補正 2】

【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】

80 % 以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法であって、15 ～ 85 重量 %、特に、30 ～ 65 重量 % のシリマリンを含有する抽出物を無水アルコール中に溶解し、必要に応じて濾過し、濃縮し、次いで乾燥させ、必要に応じて粉砕

することを特徴とする、方法。

【請求項 2】

80%以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法であって、

(a) 植物性薬剤を、中程度の極性を有する溶媒（例えば、必要に応じて水性画分を含有する、酢酸エチル、エタノール、アセトン、メタノール）を用いて、好ましくは40～80、特に好ましくは50～70 で抽出する工程、

(b) 分離し、好ましくは濾過する工程、

(c) 60 未満、好ましくは40 未満の温度で、好ましくは真空下で攪拌して濃縮する工程、および(c') 必要に応じて温水で洗浄する工程、

(d) エタノール、好ましくは96%以上のエタノール、または同様の極性の溶媒と混合し、次いで、ヘキサンまたは同様の極性の溶媒と混合し、好ましくは1～100 mbar の圧力で濃縮し、生じたエタノール-水相を除去する工程、

(e) 乾燥させ、必要に応じて粉碎する工程、

(f) 無水アルコール中、好ましくはエタノール中に溶解する工程、

(g) 必要に応じて濾過し、濃縮する工程、ならびに

(h) 乾燥させ、必要に応じて粉碎する工程

を特徴とする、方法。

【請求項 3】

工程(a)において、前記中程度の極性の溶媒は、酢酸エチル、エタノール、およびメタノールからなる群より選択され、好ましくは酢酸エチルであることを特徴とする、請求項2に記載の80%以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法。

【請求項 4】

工程(f)において、前記無水アルコールは無水C1 - C4 アルコールであることを特徴とする、請求項2に記載の80%以上のシリマリン放出率を有するミルクシスル果実抽出物を調製する方法。

【請求項 5】

請求項1から請求項4のいずれか一項に記載の方法によって得ることができるミルクシスル果実抽出物。

【請求項 6】

前記ミルクシスル果実抽出物は本質的に非晶質の結晶変性物から成る、請求項5に記載のミルクシスル果実抽出物。

【請求項 7】

前記ミルクシスル果実抽出物は非晶質の結晶変性物から成り、その結晶画分が20%未満、特に10%未満、好ましくは7%未満である、請求項5または請求項6に記載のミルクシスル果実抽出物。

【請求項 8】

肝臓および胆嚢の機能不全、特に、毒性の肝障害（脂肪肝、アルコール）、キノコ中毒などの肝臓症、急性肝不全、肝臓の壊死、肝栄養障害症、肝硬変、肝線維症、肝腫、および脂肪肝変性、肝不全、ならびに、肝炎、特にC型肝炎の処置および予防のための、請求項5から請求項7のいずれか一項に記載のミルクシスル果実抽出物。

【請求項 9】

請求項8に記載のミルクシスル果実抽出物を含有する医薬調製物。