

【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21年5月21日(2009.5.21)

【公開番号】特開2009-73850(P2009-73850A)

【公開日】平成21年4月9日(2009.4.9)

【年通号数】公開・登録公報2009-014

【出願番号】特願2008-287205(P2008-287205)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/46 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 9/107

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 21/04

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/46

A 6 1 K 47/10

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年3月10日(2009.3.10)

## 【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】

- a) 薬物学的有効量の I S A<sub>T X</sub> 2 4 7 ;
- b) ビタミン E T P G S ;
- c) M C T 油 ;
- d) 乳化剤 ; 及び
- e) エタノール

を含んでなる医薬製剤であって、水性メジウムと接触する際に透明なマイクロエマルジョンを形成する、医薬製剤。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の医薬製剤であって、約 5 ないし約 1 0 重量%の I S A<sub>T X</sub> 2 4 7、0 %より多く約 5 0 重量%までのビタミン E T P G S、0 %より多く約 5 0 重量%までの M C T 油、0 %より多く約 5 0 重量%までの乳化剤、及び約 5 ないし約 1 5 重量%のエタノールを含み、前記製剤は、室温では液体マイクロエマルジョンプレコンセントレートである、医薬製剤。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の医薬製剤であって、a : b : c : d : e の重量比が約 0 . 5 ~ 1 : 4 : 2 : 2 : 1 である、医薬製剤。

【請求項 4】

- a) 薬物学的有効量の I S A<sub>T X</sub> 2 4 7 ;
- b) ビタミン E T P G S ;
- c) M C T 油 ;
- d) ツイーン 4 0 ; 及び
- e) エタノール

を含んでなる医薬製剤であって、水性メジウムと接触する際に透明なマイクロエマルジョンを形成する、医薬製剤。

【請求項 5】

請求項 4 に記載の医薬製剤であって、約 5 %ないし約 1 0 重量%の I S A<sub>T X</sub> 2 4 7、約 2 0 %ないし約 5 0 重量%のビタミン E T P G S、約 5 %ないし約 2 0 重量%の M C T 油、約 5 %ないし約 5 0 重量%のツイーン 4 0、及び約 5 %ないし約 1 5 重量%のエタノールを含む、医薬製剤。

【請求項 6】

請求項 4 に記載の医薬製剤であって、a : b : c : d : e の重量比が約 0 . 5 ~ 1 : 4 : 2 : 2 : 1 である、医薬製剤。

【請求項 7】

- a) 薬物学的有効量の I S A<sub>T X</sub> 2 4 7 ;
- b) ビタミン E T P G S ;
- c) M C T 油 ;
- d) ツイーン 8 0 ; 及び
- e) エタノール

を含んでなる医薬製剤であって、水性メジウムと接触する際に透明なマイクロエマルシ

ンを形成する、医薬製剤。

【請求項 8】

請求項 7 に記載の医薬製剤であって、約 5 % ないし約 10 重量%の I S A<sub>T</sub>X 247、約 20 % ないし約 50 重量%のビタミン E T P G S、約 5 % ないし約 20 重量%の M C T 油、約 5 % ないし約 50 重量%のツイーン 80、約 5 % ないし約 15 重量%のエタノールを含む、医薬製剤。

【請求項 9】

請求項 7 に記載の医薬製剤であって、a : b : c : d : e の重量比が約 0.5 ~ 1 : 2 : 4 : 2 : 1 である、医薬製剤。

【請求項 10】

- a) 薬物学的有効量の I S A<sub>T</sub>X 247 ;
- b) M C T 油 ;
- c) ツイーン 80 ;
- d) トリアセチン ; 及び
- e) エタノール

を含んでなる医薬製剤であって、水性メジウムと接触する際に透明なマイクロエマルジョンを形成する、医薬製剤。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の医薬製剤であって、約 5 % ないし約 10 重量%の I S A<sub>T</sub>X 247、約 20 % ないし約 50 重量%のトリアセチン、約 5 % ないし約 50 重量%の M C T 油、約 5 % ないし約 50 重量%のツイーン 80、及び約 5 % ないし約 15 重量%のエタノールを含む、医薬製剤。

【請求項 12】

請求項 11 に記載の医薬製剤であって、a : b : c : d : e の重量比が約 0.5 ~ 1 : 5 : 3 : 1 : 1 である、医薬製剤。

【請求項 13】

- a) 薬物学的有効量の I S A<sub>T</sub>X 247 ;
- b) ツイーン 80 ;
- c) ビタミン E T P G S ;
- d) エタノール ; 及び
- e) ミリスチン酸イソプロピル

を含んでなる医薬製剤であって、水性メジウムと接触する際に透明なマイクロエマルジョンを形成する、医薬製剤。

【請求項 14】

請求項 13 に記載の医薬製剤であって、約 5 % ないし約 10 重量%の I S A<sub>T</sub>X 247、約 20 % ないし約 50 重量%のビタミン E T P G S、約 5 % ないし約 55 重量%のミリスチン酸イソプロピル、約 5 % ないし約 50 重量%のツイーン 80、及び約 5 % ないし約 15 重量%のエタノールを含む、医薬製剤。

【請求項 15】

請求項 13 に記載の医薬製剤であって、a : b : c : d : e の重量比が約 0.5 ~ 1 : 2 : 1 : 1 : 6 である、医薬製剤。

【請求項 16】

前記水性メジウムが、水、果汁（グレープフルーツジュースを除く）、茶、ミルク及びココアからなる群から選択される、請求項 1、4、7、10、または、13 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 17】

前記果汁がリンゴジュースである、請求項 16 に記載の医薬製剤。

【請求項 18】

前記医薬製剤が、局所投与、経口投与、眼内投与、静脈内投与、間質投与、皮下投与、または、筋肉内投与に適切である、請求項 1、4、7、10、または、13 のいずれか一

項に記載の医薬製剤。

【請求項 19】

前記医薬製剤が、マイクロエマルションプレコンセントレート、または、マイクロエマルションである、請求項 1、4、7、10、または、13 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 20】

前記 I S A <sub>T</sub> X 247 のバイオアベイラビリティが約 30 % より大きい、請求項 1、4、7、10、13、または、18 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 21】

さらに、保護コロイドとしての生体適合性ポリマー類、懸濁液安定剤又は増量剤、賦形剤、結合剤及び担体を含む、請求項 1、4、7、10、13、または、18 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 22】

生体適合性ポリマーが、ポリオキシエチレングリコール化天然又は水素化植物油、クレモフォル（商標）、ニッコル（商標）、ツイーン類、ポリオキシエチレン - ポリオキシプロピレン ブロックコポリマー類、レシチン類、プロピレングリコールモノ - 及びジ - 脂肪酸エステル類、及び、プロピレングリコール カプリル - カプリン酸ジエステルからなる群から選択される、請求項 21 に記載の医薬製剤。

【請求項 23】

ツイーンが、ポリオキシエチレン（20）ソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレン（20）ソルビタンモノパルミテート、ポリオキシエチレン（20）ソルビタントリオレート、ポリオキシエチレン（20）ソルビタンモノステアレート、ポリオキシエチレン（20）ソルビタンモノオレート、ポリオキシエチレン（20）ソルビタントリスステアレート、ポリオキシエチレン（4）ソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレン（4）ソルビタンモノステアレート、及びポリオキシエチレン（5）ソルビタンモノオレートからなる群から選択される、請求項 22 に記載の医薬製剤。

【請求項 24】

請求項 1、4、7、10、13、または、18 のいずれか一項に記載の医薬製剤の有効量を含む免疫抑制を生成するための組成物であって、該組成物は、免疫抑制を必要とする対象に投与される、組成物。

【請求項 25】

前記対象の体重 1 kg あたり前記医薬製剤約 0.5 ないし 3 mg / 日で投与されるように処方される、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 26】

前記組成物が 1 日 1 回投与されるように処方される、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 27】

前記組成物が 1 日 2 回投与されるように処方される、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 28】

前記組成物が、前記対象の炎症性又は自己免疫疾患又は障害を治療するのに使用される、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 29】

請求項 1、4、7、10、13、または、18 のいずれか一項に記載の医薬製剤を調製することによる、I S A <sub>T</sub> X 247 の免疫抑制効果を増強するための方法。

【請求項 30】

前記プレコンセントレートが、プレコンセントレート約 1 部対水性メジウム約 10 ないし約 100 部の割合で水性メジウムと混合される、請求項 1、4、7、10、13、または、18 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 31】

前記水性メジウムが、水、果汁（グレープフルーツジュースを除く）、茶、ミルク及びココアからなる群から選択される、請求項 30 に記載の医薬製剤。

**【請求項 3 2】**

前記果汁がリンゴジュースである、請求項 3 1 に記載の医薬製剤。

**【請求項 3 3】**

経口製剤がソフトゼラチンカプセルに封入されている、請求項 1 8 に記載の医薬製剤。

**【請求項 3 4】**

対象に投与した際に免疫抑制を生成するための薬剤の製造における、請求項 1、4、7、10、または、13 のいずれか一項に記載の医薬製剤の使用。

**【請求項 3 5】**

前記薬剤が、前記対象の体重 1 k g あたり前記医薬製剤約 0 . 5 ないし 3 m g / 日の投与に適する、請求項 3 4 に記載の使用。

**【請求項 3 6】**

前記薬剤が 1 日 1 回投与される、請求項 3 4 に記載の使用。

**【請求項 3 7】**

前記薬剤が 1 日 2 回投与される、請求項 3 4 に記載の使用。

**【請求項 3 8】**

前記薬剤が、前記対象の炎症性又は自己免疫疾患又は障害を治療するために使用されるものである、請求項 3 4 に記載の使用。

**【請求項 3 9】**

I S A <sub>T</sub> X 2 4 7 の免疫抑制効果を増強するための薬剤の製造における、請求項 1、4、7、10、または、13 のいずれか一項に記載の医薬製剤の使用。