

【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 11 月 26 日 (2020.11.26)

【公表番号】特表 2019-531352 (P2019-531352A)

【公表日】令和 1 年 10 月 31 日 (2019.10.31)

【年通号数】公開・登録公報 2019-044

【出願番号】特願 2019-541688 (P2019-541688)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/51 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 37/08

A 6 1 K 9/51

A 6 1 K 47/36

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 10 月 15 日 (2020.10.15)

【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】

それを必要とする対象において免疫疾患を治療するための医薬組成物であって、ナノ粒子中に被包されたベルベリンまたはベルベリンの類似体もしくは誘導体、またはその塩を含むナノ粒子を含む、医薬組成物。

【請求項 2】

ベルベリンまたはその塩が、前記ナノ粒子中に被包されている、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記ナノ粒子がアニオン性ポリマーを含む、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記アニオン性ポリマーがアニオン性多糖である、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記アニオン性ポリマーが硫酸化多糖である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記アニオン性ポリマーがアニオン性アミノグリカンポリマーである、請求項 3 に記載の医薬組成物。

**【請求項 7】**

前記アニオン性ポリマーが硫酸化アミノグリカンポリマーである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

**【請求項 8】**

前記ナノ粒子が、ベルベリン、またはベルベリンの類似体もしくは誘導体、またはその塩と前記アニオン性ポリマーとを、約 1 : 5 ~ 約 5 : 5、例えば、約 1 : 5 ; 約 2 : 5 ; 約 3 : 5 ; 約 4 : 5 または約 5 : 5 の範囲の重量比で含む、請求項 3 から 7 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 9】**

前記ナノ粒子がヘパリンを含む、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 10】**

前記ナノ粒子が、ベルベリン、またはベルベリンの類似体もしくは誘導体、またはその塩とヘパリンとを、約 1 : 5 ~ 約 5 : 5、例えば、約 1 : 5 ; 約 2 : 5 ; 約 3 : 5 ; 約 4 : 5 または約 5 : 5 の範囲の重量比で含む、請求項 9 に記載の医薬組成物。

**【請求項 11】**

前記ナノ粒子が多糖を含む、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 12】**

前記ナノ粒子がリポ多糖を含む、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の医薬組成物

。

**【請求項 13】**

前記ナノ粒子がアミノグリコシドポリマーを含む、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 14】**

前記ナノ粒子がキトサンを含む、請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の医薬組成物

。

**【請求項 15】**

前記ナノ粒子がベルベリン、ヘパリンおよびキトサンを含む、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 16】**

前記ナノ粒子が、ヘパリンとキトサンとを、約 5 : 1 ~ 5 : 5 の重量比、例えば約 5 : 1 ~ 約 5 : 2 . 5、例えば約 5 : 1、約 5 : 1 . 5、約 5 : 2 または約 5 : 2 . 5 の重量比で含む、請求項 1 から 15 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 17】**

前記ナノ粒子が、ベルベリン、ヘパリンおよびキトサンを、約 2 : 5 : 1 . 5、約 3 : 5 : 1 . 5、または約 4 : 5 : 1 . 5 の重量比で含む、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 18】**

前記ナノ粒子が、約 - 10 ~ 約 - 50 mV、例えば、約 - 10 mV、約 - 15 mV、約 - 20 mV、約 - 25 mV、約 - 30 mV、約 - 35 mV、約 - 40 mV、約 - 45 mV、または約 - 50 mV の範囲のゼータ ( ) 電位を有する、請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 19】**

前記ナノ粒子が、約 5 nm ~ 約 1000 nm、例えば、約 10 nm ~ 約 1000 nm、約 20 nm ~ 約 1000 nm、約 50 nm ~ 約 1000 nm、約 100 nm ~ 約 1000 nm、約 200 nm ~ 約 1000 nm ; 例えば、約 100 nm、約 200 nm、約 300 nm、約 400 nm、約 500 nm、約 600 nm、約 700 nm、約 800 nm、約 900 nm、または約 1000 nm の範囲の平均粒径を有する、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 20】**

前記組成物が経口投与される、請求項 1 から 19 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 1】

前記組成物が反復投与される、請求項 1 から 2 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 2】

前記組成物が 1 日に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 3】

前記組成物がほぼ 1 日おきの頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 4】

前記組成物が週に約 2 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 5】

前記組成物が週に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 6】

前記組成物が 2 週間に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 7】

前記組成物が月に約 2 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 8】

前記組成物が月に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 9】

前記組成物が 2 カ月に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 0】

前記組成物が 3 カ月に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 1】

前記組成物が 4 カ月に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 2】

前記組成物が 5 カ月に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 3】

前記組成物が 6 カ月に約 1 回の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 4】

前記組成物が年に約 2 回（半年ごと）の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 5】

前記組成物が年に約 1 回（年ごと）の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 6】

前記組成物が 2 年に約 1 回（隔年）の頻度で投与される、請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 7】

単回投与が、少なくとも約 1 週間、少なくとも約 1 カ月間、少なくとも約 6 カ月間、少なくとも約 1 年間、または少なくとも約 2 年間の期間にわたって免疫疾患を治療するのに

有効である、請求項 1 から 36 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 38】

前記免疫疾患が I g E 媒介性免疫疾患である、請求項 1 から 37 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 39】

前記免疫疾患が B 細胞媒介性免疫疾患である、請求項 1 から 38 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 40】

免疫障害が、アレルギー、喘息、アレルギー性鼻炎、関節リウマチ、慢性閉塞性肺疾患、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、セリアック病、乾癬、1 型糖尿病、全身性エリテマトーデス、ギランバレー症候群、アトピー性皮膚炎、移植片対宿主病および移植拒絶反応から選択される、請求項 1 から 39 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 41】

前記免疫障害がアレルギーである、請求項 1 から 40 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 42】

前記アレルギーが食物アレルギーである、請求項 41 に記載の医薬組成物。

【請求項 43】

前記アレルギーが、ピーナッツ、木の実（例えば、アーモンド、ブラジルナッツ、カシューナッツ、マカダミアナッツ、またはクルミ）、大豆製品、乳製品、卵製品、魚製品、甲殻類製品、グルテンまたは小麦製品に対する食物アレルギーである、請求項 42 に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0167

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0167】

本発明の多数の実施形態を記載した。それにもかかわらず、本発明の精神および範囲から逸脱することなく、様々な改変をなし得ることが理解される。したがって、他の実施形態は、以下の特許請求の範囲の範囲内にある。本出願において引用されているすべての特許、特許出願、および刊行物を含む各参考文献は、その全体が参照により本明細書に組み込まれる。

本発明は、以下の態様を包含し得る。

[ 1 ]

それを必要とする対象において免疫疾患を治療する方法であって、ナノ粒子中に被包されたベルベリンまたはベルベリンの類似体もしくは誘導体、またはその塩を含むナノ粒子を含む、有効量の組成物を前記対象に投与することを含む、方法。

[ 2 ]

ベルベリンまたはその塩が、前記ナノ粒子中に被包されている、上記 [ 1 ] に記載の方法。

[ 3 ]

前記ナノ粒子がアニオン性ポリマーを含む、上記 [ 1 ] または [ 2 ] に記載の方法。

[ 4 ]

前記アニオン性ポリマーがアニオン性多糖である、上記 [ 1 ] から [ 3 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 5 ]

前記アニオン性ポリマーが硫酸化多糖である、上記 [ 4 ] に記載の方法。

[ 6 ]

前記アニオン性ポリマーがアニオン性アミノグリカンポリマーである、上記 [ 3 ] に記載の方法。

[ 7 ]

前記アニオン性ポリマーが硫酸化アミノグリカンポリマーである、上記 [ 6 ] に記載の方法。

[ 8 ]

前記ナノ粒子が、ベルベリン、またはベルベリンの類似体もしくは誘導体、またはそれらの塩と前記アニオン性ポリマーとを、約 1 : 5 ~ 約 5 : 5、例えば、約 1 : 5 ; 約 2 : 5 ; 約 3 : 5 ; 約 4 : 5 または約 5 : 5 の範囲の重量比で含む、上記 [ 3 ] から [ 7 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 9 ]

前記ナノ粒子がヘパリンを含む、上記 [ 1 ] から [ 8 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 10 ]

前記ナノ粒子が、ベルベリン、またはベルベリンの類似体もしくは誘導体、またはそれらの塩とヘパリンとを、約 1 : 5 ~ 約 5 : 5、例えば、約 1 : 5 ; 約 2 : 5 ; 約 3 : 5 ; 約 4 : 5 または約 5 : 5 の範囲の重量比で含む、上記 [ 9 ] に記載の方法。

[ 11 ]

前記ナノ粒子が多糖を含む、上記 [ 1 ] から [ 10 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 12 ]

前記ナノ粒子がリボ多糖を含む、上記 [ 1 ] から [ 11 ] のいずれか一項に記載の方法

。

[ 13 ]

前記ナノ粒子がアミノグリコシドポリマーを含む、上記 [ 1 ] から [ 12 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 14 ]

前記ナノ粒子がキトサンを含む、上記 [ 1 ] から [ 13 ] のいずれか一項に記載の方法

。

[ 15 ]

前記ナノ粒子がベルベリン、ヘパリンおよびキトサンを含む、上記 [ 1 ] から [ 14 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 16 ]

前記ナノ粒子が、ヘパリンとキトサンとを、約 5 : 1 ~ 5 : 5 の重量比、例えば約 5 : 1 ~ 約 5 : 2 . 5、例えば約 5 : 1、約 5 : 1 . 5、約 5 : 2 または約 5 : 2 . 5 の重量比で含む、上記 [ 1 ] から [ 15 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 17 ]

前記ナノ粒子が、ベルベリン、ヘパリンおよびキトサンを、約 2 : 5 : 1 . 5、約 3 : 5 : 1 . 5、または約 4 : 5 : 1 . 5 の重量比で含む、上記 [ 1 ] から [ 16 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 18 ]

前記ナノ粒子が、約 - 10 ~ 約 - 50 mV、例えば、約 - 10 mV、約 - 15 mV、約 - 20 mV、約 - 25 mV、約 - 30 mV、約 - 35 mV、約 - 40 mV、約 - 45 mV、または約 - 50 mV の範囲のゼータ ( ) 電位を有する、上記 [ 1 ] から [ 17 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 19 ]

前記ナノ粒子が、約 5 nm ~ 約 1000 nm、例えば、約 10 nm ~ 約 1000 nm、約 20 nm ~ 約 1000 nm、約 50 nm ~ 約 1000 nm、約 100 nm ~ 約 1000 nm、約 200 nm ~ 約 1000 nm ; 例えば、約 100 nm、約 200 nm、約 300 nm、約 400 nm、約 500 nm、約 600 nm、約 700 nm、約 800 nm、約 900 nm、または約 1000 nm の範囲の平均粒径を有する、上記 [ 1 ] から [ 18 ] の

いずれか一項に記載の方法。

[ 2 0 ]

前記組成物が経口投与される、上記 [ 1 ] から [ 1 9 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 1 ]

前記組成物が反復投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 0 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 2 ]

前記組成物が 1 日に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 3 ]

前記組成物がほぼ 1 日おきの頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 4 ]

前記組成物が週に約 2 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 5 ]

前記組成物が週に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 6 ]

前記組成物が 2 週間に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 7 ]

前記組成物が月に約 2 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 8 ]

前記組成物が月に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 2 9 ]

前記組成物が 2 カ月に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 0 ]

前記組成物が 3 カ月に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 1 ]

前記組成物が 4 カ月に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 2 ]

前記組成物が 5 カ月に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 3 ]

前記組成物が 6 カ月に約 1 回の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 4 ]

前記組成物が年に約 2 回（半年ごと）の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 5 ]

前記組成物が年に約 1 回（年ごと）の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 6 ]

前記組成物が 2 年に約 1 回（隔年）の頻度で投与される、上記 [ 1 ] から [ 2 1 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 7 ]

単回投与が、少なくとも約 1 週間、少なくとも約 1 カ月間、少なくとも約 6 カ月間、少なくとも約 1 年間、または少なくとも約 2 年間の期間にわたって免疫疾患を治療するのに有効である、上記 [ 1 ] から [ 3 6 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 8 ]

前記免疫疾患が I g E 媒介性免疫疾患である、上記 [ 1 ] から [ 3 7 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 3 9 ]

前記免疫疾患が B 細胞媒介性免疫疾患である、上記 [ 1 ] から [ 3 8 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 4 0 ]

免疫障害が、アレルギー、喘息、アレルギー性鼻炎、関節リウマチ、慢性閉塞性肺疾患、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、セリアック病、乾癬、1 型糖尿病、全身性エリテマトーデス、ギランバレー症候群、アトピー性皮膚炎、移植片対宿主病および移植拒絶反応から選択される、上記 [ 1 ] から [ 3 9 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 4 1 ]

前記免疫障害がアレルギーである、上記 [ 1 ] から [ 4 0 ] のいずれか一項に記載の方法。

[ 4 2 ]

前記アレルギーが食物アレルギーである、上記 [ 4 1 ] に記載の方法。

[ 4 3 ]

前記アレルギーが、ピーナッツ、木の実（例えば、アーモンド、ブラジルナッツ、カシューナッツ、マカダミアナッツ、またはクルミ）、大豆製品、乳製品、卵製品、魚製品、甲殻類製品、グルテンまたは小麦製品に対する食物アレルギーである、上記 [ 4 2 ] に記載の方法。