(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2005 年12 月15 日 (15.12.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/117878 A1

(51) 国際特許分類[7]: A61K 31/4745, 9/127, 47/04, 47/18, 47/24, 47/30, A61P 35/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/009953

(22) 国際出願日: 2005 年5 月31 日 (31.05.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2004-163742 2004 年6 月1 日 (01.06.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): テルモ株式会社 (TERUMO KABUSHIKI KAISHA) [JP/JP]; 〒1510072 東京都渋谷区幡ヶ谷２丁目４４番１号 Tokyo (JP). 株式会社ヤクルト本社 (KABUSHIKI KAISHA YAKULT HONSHA) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋１丁目１番１９号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 吉野 敬亮 (YOSHINO, Keisuke) [JP/JP]; 〒2590151 神奈川県足柄上郡中井町井ノ口１５００番地 テルモ株式会社内 Kanagawa (JP). 野沢 滋典 (NOZAWA, Shigenori) [JP/JP]; 〒2590151 神奈川県足柄上郡中井町井ノ口１５００番地 テルモ株式会社内 Kanagawa (JP). 磯崎 正史 (ISOZAKI, Masashi) [JP/JP]; 〒2590151 神奈川県足柄上郡中井町井ノ口１５００番地 テルモ株式会社内 Kanagawa (JP). 澤田 誠吾 (SAWADA, Seigo) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋１丁目１番１９号 株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 加藤 幾雄 (KATO, Ikuo) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋１丁目１番１９号 株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP). 松崎 健 (MATSUZAKI, Takeshi) [JP/JP]; 〒1058660 東京都港区東新橋１丁目１番１９号 株式会社ヤクルト本社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 渡辺 望稔, 外 (WATANABE, Mochitoshi et al.); 〒1010032 東京都千代田区岩本町２丁目１２番５号 早川トナカイビル３階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: IRINOTECAN PREPARATION

(54) 発明の名称: イリノテカン製剤

(57) Abstract: An irinotecan preparation having irinotecan and/or a salt thereof highly carried by a closed vesicle carrier, which exhibits a strikingly prolonged retention in blood as compared with that of conventional irinotecan liposome preparations and is capable of being present in blood for a prolonged period of time. There is provided an irinotecan preparation comprising closed vesicles formed of a lipid membrane wherein irinotecan and/or a salt thereof is sealed in a concentration of at least 0.07 mol/mol (medicine mol/total membrane lipid mol). The irinotecan preparation preferably has an ion gradient between an inner water phase and an outer water phase within the closed vesicles. The closed vesicles are preferably liposomes, and the liposomes preferably have only the external surface thereof modified with a surface modifier containing a hydrophilic polymer.

(57) 要約: 閉鎖小胞担体にイリノテカンおよび／またはその塩を高担持し、従来公知のイリノテカンリポソーム製剤に比べて血中滞留性が飛躍的に向上し、長期間血中に存在することができるイリノテカン製剤の提供。脂質膜で形成される閉鎖小胞に、イリノテカンおよび／またはその塩を、少なくとも０.０７mol／mol（薬剤mol／膜総脂質mol）の濃度で内封したイリノテカン製剤。イリノテカン製剤は、好ましくは閉鎖小胞の内水相と外水相との間にイオン勾配を有する。閉鎖小胞は好ましくはリポソームであり、該リポソームは好ましくは外表面のみが親水性高分子を含む表面修飾剤で修飾されている。

WO 2005/117878 A1