

【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3年1月14日(2021.1.14)

【公表番号】特表2020-508993(P2020-508993A)

【公表日】令和2年3月26日(2020.3.26)

【年通号数】公開・登録公報2020-012

【出願番号】特願2019-544856(P2019-544856)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 P	17/10	(2006.01)
A 6 1 K	8/34	(2006.01)
A 6 1 K	8/891	(2006.01)
A 6 1 K	8/39	(2006.01)
A 6 1 Q	19/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/08
A 6 1 K	9/08
A 6 1 K	47/24
A 6 1 K	47/10
A 6 1 P	17/10
A 6 1 K	8/34
A 6 1 K	8/891
A 6 1 K	8/39
A 6 1 Q	19/00

【手続補正書】

【提出日】令和2年11月26日(2020.11.26)

【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】

2-(2-エトキシエトキシ)エタノール溶媒である第1の溶媒中の2-(2-エトキシエトキシ)エタノールの溶液を含む、局所用医薬組成物。

【請求項2】

前記第1の溶媒がシロキサンである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記第1の溶媒が、

a) 2個または3個のケイ素原子を含有する、
 b) イソプロピルアルコールの揮発性レベルとほぼ同じ揮発性レベルを有する、および
 /または
 c) ヘキサメチルジシロキサン、オクタメチルトリシロキサンおよびそれらの組合せからなる群から選択される、

請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

第2の溶媒をさらに含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記第2の溶媒が低分子量アルコールである、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記第1の溶媒よりも揮発性が低い第3の溶媒をさらに含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記第3の溶媒が残留溶媒である、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記第3の溶媒が、アルキルポリプロピレングリコール／ポリエチレングリコールエーテル（アルキルPEG／PPGエーテル）および／または脂肪族アルコールから選択される残留溶媒である、請求項7に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

2-(2-エトキシエトキシ)エタノール、前記第1の溶媒および揮発性の第2の溶媒から本質的になる、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

2-(2-エトキシエトキシ)エタノール、前記第1の溶媒、および前記第1の溶媒よりも揮発性が低い第3の溶媒から本質的になる、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

2-(2-エトキシエトキシ)エタノール、前記第1の溶媒、揮発性の第2の溶媒、および前記第1の溶媒よりも揮発性が低い第3の溶媒から本質的になる、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記アルキルPEG／PPGエーテルが、

a) 10～50の間のPG単位のPEG／PPG鎖長、および2～20個の間の炭素のエーテル構成成分を有しており、前記PG単位と前記エーテル構成成分の前記炭素の合計が20～60の間である、

b) 24時間にわたり、5%未満が皮膚の温度で蒸発するような低揮発性を有する、

c) 約30またはそれ未満で液体である、および／または

d)ステアリルアルコールおよびブチルアルコールのポリプロピレングリコールエーテルからなる群から選択される、

請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

アルキルPEG／PPGエーテルの相対量が、

a) 以下の群：少なくとも1%w/w、少なくとも2%w/w、少なくとも3%w/w、少なくとも4%w/w、および少なくとも5%w/wから選択される、および／または

b) 最大濃度が50%w/wである、または

c) 最大濃度が80%w/wである、

請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記脂肪族アルコールが、

a) 24時間にわたり、5%未満が皮膚の温度で蒸発するような低揮発性を有する、

b) C12～22脂肪族アルコールである、

c) 約30またはそれ未満で液体である、および／または

d)オレイルアルコール、イソステアリルアルコール、オクチルドデシルアルコールおよび2-ヘキシリデシルアルコールからなる群から選択される、

請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記脂肪族アルコールの相対量が、

a) 以下の群：少なくとも 1 % w / w、少なくとも 2 % w / w、少なくとも 3 % w / w、少なくとも 4 % w / w、および少なくとも 5 % w / w から選択される、

b) 最大濃度が 50 % w / w である、または

c) 最大濃度が 80 % w / w である、

請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記低分子量アルコールが、

a) 周囲温度において液体である、

b) イソプロピルアルコールの揮発性レベルとほぼ同じ揮発性レベルを有する、および / または

c) C2 ~ 6 アルコールおよびその組合せからなる群から選択される、または

d) C2 ~ 4 アルコールおよびその組合せからなる群から選択される、および / または

e) エチルアルコール、n-プロパノール、イソプロピルアルコールおよびそれらの組合せからなる群から選択される、

請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

低分子量アルコールの相対量が、

a) 以下の群：少なくとも 2 % w / w、3 % w / w、4 % w / w、5 % w / w、6 % w / w、7 % w / w、8 % w / w、9 % w / w、10 % w / w、11 % w / w、12 % w / w、13 % w / w、14 % w / w、15 % w / w、20 % w / w、25 % w / w、30 % w / w、35 % w / w、40 % w / w、45 % w / w から選択される、

b) 最大濃度が 50 % w / w である、

c) 最大濃度が、60 % w / w、70 % w / w、80 % w / w、または

d) 1 % w / w ~ 50 % w / w、1 % w / w ~ 40 %、1 % w / w ~ 30 % w / w、1 % w / w ~ 20 % w / w、1 % w / w ~ 10 % w / w の間である、

請求項 15 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

2-(2-エトキシエトキシ)エタノールの濃度が、

a) 少なくとも 2 % w / w、少なくとも 3 % w / w、少なくとも 4 % w / w、少なくとも 5 % w / w、少なくとも 6 % w / w、少なくとも 7 % w / w、少なくとも 8 % w / w、少なくとも 9 % w / w、少なくとも 10 % w / w、少なくとも 11 % w / w、少なくとも 12 % w / w、少なくとも 13 % w / w、少なくとも 14 % w / w および少なくとも 15 % w / w、または

b) 少なくとも 20 % w / w、少なくとも 30 % w / w、少なくとも 40 % w / w、少なくとも 50 % w / w、少なくとも 60 % w / w、少なくとも 70 % w / w、少なくとも 80 % w / w、少なくとも 90 % w / w、少なくとも 95 % w / w および少なくとも 99 % w / w

からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

ざ瘡の処置を必要とする患者において、ざ瘡を処置または予防するための医薬組成物であって、前記医薬組成物が局所投与されることを特徴とする、医薬組成物。

【請求項 20】

ざ瘡を必要とする患者におけるざ瘡を予防または処置するための請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載の医薬組成物の製造のための 2-(2-エトキシエトキシ)エタノールおよび第 1 の溶媒の使用。

【請求項 21】

ざ瘡の処置または予防のための、2-(2-エトキシエトキシ)エタノールおよび第 1 の溶媒を含む局所用医薬組成物。

【請求項 22】

前記第 1 の溶媒がシロキサンである、請求項 20 に記載の使用または請求項 21 に記載

の組成物。

【請求項 2 3】

ざ瘡の局所処置または予防に使用するための、2 - (2 - エトキシエトキシ) エタノールを含む組成物。

【請求項 2 4】

2 - (2 - エトキシエトキシ) エタノール、および 1 種もしくは複数種の薬学的に許容される担体、アジュバントまたはビヒクルを含む、局所用医薬組成物であって、非 2 - (2 - エトキシエトキシ) エタノール活性医薬成分を含まない、局所用医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 5 0

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 5 0】

前述の実施例から、本発明による transcutol を使用すると、ざ瘡の処置および / またはその治癒の改善することができる期待される。一般に、本発明による処置によって、治癒期間の短縮がもたらされる。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

2 - (2 - エトキシエトキシ) エタノール溶媒である第 1 の溶媒中の 2 - (2 - エトキシエトキシ) エタノールの溶液を含む、局所用医薬組成物。

(項目 2)

前記第 1 の溶媒がシロキサンである、項目 1 に記載の医薬組成物。

(項目 3)

前記第 1 の溶媒が、

a) 2 個または 3 個のケイ素原子を含有する、

b) イソプロピルアルコールの揮発性レベルとほぼ同じ揮発性レベルを有する、および / または

c) ヘキサメチルジシロキサン、オクタメチルトリシロキサンおよびそれらの組合せからなる群から選択される、

項目 1 に記載の医薬組成物。

(項目 4)

第 2 の溶媒をさらに含む、項目 1 に記載の医薬組成物。

(項目 5)

前記第 2 の溶媒が低分子量アルコールである、項目 4 に記載の医薬組成物。

(項目 6)

前記第 1 の溶媒よりも揮発性が低い第 3 の溶媒をさらに含む、項目 1 に記載の医薬組成物。

(項目 7)

前記第 3 の溶媒が残留溶媒である、項目 6 に記載の医薬組成物。

(項目 8)

前記第 3 の溶媒が、アルキルポリプロピレングリコール / ポリエチレングリコールエーテル (アルキル P E G / P P G エーテル) および / または脂肪族アルコールから選択される残留溶媒である、項目 7 に記載の医薬組成物。

(項目 9)

2 - (2 - エトキシエトキシ) エタノール、前記第 1 の溶媒および揮発性の第 2 の溶媒から本質的になる、項目 1 に記載の医薬組成物。

(項目 10)

2 - (2 - エトキシエトキシ) エタノール、前記第 1 の溶媒、および前記第 1 の溶媒よ

りも揮発性が低い第3の溶媒から本質的になる、項目1に記載の医薬組成物。

(項目11)

2-(2-エトキシエトキシ)エタノール、前記第1の溶媒、揮発性の第2の溶媒、および前記第1の溶媒よりも揮発性が低い第3の溶媒から本質的になる、項目1に記載の医薬組成物。

(項目12)

前記アルキルPEG/PPGエーテルが、

a) 10~50の間のPG単位のPEG/PPG鎖長、および2~20個の間の炭素のエーテル構成成分を有しており、前記PG単位と前記エーテル構成成分の前記炭素の合計が20~60の間である、

b) 24時間にわたり、5%未満が皮膚の温度で蒸発するような低揮発性を有する、

c) 約30またはそれ未満で液体である、および/または

d) ステアリルアルコールおよびブチルアルコールのポリプロピレングリコールエーテルからなる群から選択される、

項目8に記載の医薬組成物。

(項目13)

アルキルPEG/PPGエーテルの相対量が、

a) 以下の群：少なくとも1%w/w、少なくとも2%w/w、少なくとも3%w/w、少なくとも4%w/w、および少なくとも5%w/wから選択される、および/または

b) 最大濃度が50%w/wである、または

c) 最大濃度が80%w/wである、

項目8に記載の医薬組成物。

(項目14)

前記脂肪族アルコールが、

a) 24時間にわたり、5%未満が皮膚の温度で蒸発するような低揮発性を有する、

b) C12~22脂肪族アルコールである、

c) 約30またはそれ未満で液体である、および/または

d) オレイルアルコール、イソステアリルアルコール、オクチルドデシルアルコールおよび2-ヘキシルデシルアルコールからなる群から選択される、

項目8に記載の医薬組成物。

(項目15)

前記脂肪族アルコールの相対量が、

a) 以下の群：少なくとも1%w/w、少なくとも2%w/w、少なくとも3%w/w、少なくとも4%w/w、および少なくとも5%w/wから選択される、

b) 最大濃度が50%w/wである、または

c) 最大濃度が80%w/wである、

項目8に記載の医薬組成物。

(項目16)

前記低分子量アルコールが、

a) 周囲温度において液体である、

b) イソプロピルアルコールの揮発性レベルとほぼ同じ揮発性レベルを有する、および/または

c) C2~6アルコールおよびその組合せからなる群から選択される、または

d) C2~4アルコールおよびその組合せからなる群から選択される、および/または

e) エチルアルコール、n-プロパノール、イソプロピルアルコールおよびそれらの組合せからなる群から選択される、

項目5に記載の医薬組成物。

(項目17)

低分子量アルコールの相対量が、

a) 以下の群：少なくとも2%w/w、3%w/w、4%w/w、5%w/w、6%w

/ w、7 % w / w、8 % w / w、9 % w / w、10 % w / w、11 % w / w、12 % w / w、13 % w / w、14 % w / w、15 % w / w、20 % w / w、25 % w / w、30 % w / w、35 % w / w、40 % w / w、45 % w / wから選択される。

b) 最大濃度が50 % w / wである。

c) 最大濃度が、60 % w / w、70 % w / w、80 % w / w、または

d) 1 % w / w ~ 50 % w / w、1 % w / w ~ 40 %、1 % w / w ~ 30 % w / w、1 % w / w ~ 20 % w / w、1 % w / w ~ 10 % w / wの間である。

項目15に記載の医薬組成物。

(項目18)

2-(2-エトキシエトキシ)エタノールの濃度が、

a) 少なくとも2 % w / w、少なくとも3 % w / w、少なくとも4 % w / w、少なくとも5 % w / w、少なくとも6 % w / w、少なくとも7 % w / w、少なくとも8 % w / w、少なくとも9 % w / w、少なくとも10 % w / w、少なくとも11 % w / w、少なくとも12 % w / w、少なくとも13 % w / w、少なくとも14 % w / wおよび少なくとも15 % w / w、または

b) 少なくとも20 % w / w、少なくとも30 % w / w、少なくとも40 % w / w、少なくとも50 % w / w、少なくとも60 % w / w、少なくとも70 % w / w、少なくとも80 % w / w、少なくとも90 % w / w、少なくとも95 % w / wおよび少なくとも99 % w / w

からなる群から選択されることを特徴とする、項目1に記載の医薬組成物。

(項目19)

そのような処置を必要とする患者において、ざ瘡を処置または予防するための方法であって、予防有効量または治療有効量の前記項目のいずれか一項に記載の医薬組成物を局所投与するステップを含む、方法。

(項目20)

それを必要とする患者におけるざ瘡を予防または処置するための前記項目のいずれか一項に記載の医薬組成物の製造のための2-(2-エトキシエトキシ)エタノールおよび第1の溶媒の使用。

(項目21)

ざ瘡の処置または予防のための、2-(2-エトキシエトキシ)エタノールおよび第1の溶媒を含む局所用医薬組成物。

(項目22)

前記第1の溶媒がシロキサンである、項目20に記載の使用または項目21に記載の組成物。

(項目23)

ざ瘡の予防または処置のための、前記項目のいずれか一項に記載の医薬組成物の使用。

(項目24)

ざ瘡の局所処置または予防に使用するための、2-(2-エトキシエトキシ)エタノール。

(項目25)

2-(2-エトキシエトキシ)エタノール、および1種もしくは複数種の薬学的に許容される担体、アジュバントまたはビヒクルを含む、局所用医薬組成物であって、非2-(2-エトキシエトキシ)エタノール活性医薬成分を含まない、局所用医薬組成物。