

【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25年9月19日 (2013.9.19)

【公表番号】特表2013-503203(P2013-503203A)

【公表日】平成25年1月31日 (2013.1.31)

【年通号数】公開・登録公報2013-005

【出願番号】特願2012-527086(P2012-527086)

【国際特許分類】

|         |        |           |
|---------|--------|-----------|
| A 6 1 K | 31/573 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/12   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/10  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/34  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/20  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/12  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/14  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/46  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/58  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/00  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/06  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/08  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 37/08  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/18  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/38  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/32  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/36  | (2006.01) |
| A 6 1 M | 11/00  | (2006.01) |

【 F I 】

|         |        |
|---------|--------|
| A 6 1 K | 31/573 |
| A 6 1 K | 9/12   |
| A 6 1 K | 47/10  |
| A 6 1 K | 47/34  |
| A 6 1 K | 47/20  |
| A 6 1 K | 47/12  |
| A 6 1 K | 47/14  |
| A 6 1 K | 47/46  |
| A 6 1 K | 31/58  |
| A 6 1 P | 17/00  |
| A 6 1 P | 17/06  |
| A 6 1 P | 17/08  |
| A 6 1 P | 37/08  |
| A 6 1 K | 47/18  |
| A 6 1 K | 47/38  |
| A 6 1 K | 47/32  |
| A 6 1 K | 47/36  |
| A 6 1 M | 11/00  |

A

【手続補正書】

【提出日】平成25年8月7日 (2013.8.7)

【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】

噴射剤を含まないスプレー可能局所用医薬組成物であって、ステロイドと、乳化剤と、ポリマーと、水と、水非混和性物質と、浸透促進剤とを含む、組成物。

【請求項 2】

前記浸透促進剤が、約 0.001 重量パーセント～約 15 重量パーセントの量で存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

ステロイドが、ジプロピオン酸アルクロメタゾン、ジプロピオン酸ベクロメタゾン、ジプロピオン酸ベタメタゾン、吉草酸ベタメタゾン、フルオシノロンアセトニド、プロピオン酸ハロベタゾール、アセボン酸ヒドロコルチゾン、酢酸ヒドロコルチゾン、吉草酸ヒドロコルチゾン、酪酸ヒドロコルチゾン、フロ酸モメタゾン、トリアムシノロンアセトニド、ピバル酸クロコルトロン、プロピオン酸クロベタゾール、デソキシメタゾン、プロピオン酸フルチカゾンからなる群より選択される、請求項 1～2 に記載の組成物。

【請求項 4】

浸透促進剤が、ポリオールおよびエステル、エーテル、スルホキシド、脂肪酸、脂肪酸エステル、またはその任意の組み合わせからなる群より選択される、請求項 1～3 に記載の組成物。

【請求項 5】

浸透促進剤が、ポリエチレングリコール、ブタンジオール、モノラウリン酸ポリエチレングリコール、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジメチルスルホキシド、デシルメチルスルホキシド、ラウリン酸、オレイン酸、吉草酸、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、プロピオン酸メチル、オレイン酸エチル、またはその任意の組み合わせからなる群より選択される、請求項 1～4 に記載の組成物。

【請求項 6】

水非混和性物質が、植物油、飽和パラフィン油、鉱油、脂肪酸、天然脂肪酸の脂肪酸エステル、動物または植物起源のトリグリセリド、中鎖トリグリセリド、モノグリセリド、ジグリセリドおよび/またはトリグリセリドの混合物、ろう、水素化植物油、あるいはその任意の組み合わせからなる群より選択される、請求項 1～5 に記載の組成物。

【請求項 7】

乳化剤が、陽イオン界面活性剤、陰イオン界面活性剤、両性イオン界面活性剤、両性界面活性剤、またはその任意の組み合わせからなる群より選択される、請求項 1～6 に記載の組成物。

【請求項 8】

乳化剤が、ソルビタン脂肪酸エステル、脂肪酸とソルビトールならびにその一無水物および二無水物との部分エステルの混合物、ステアリン酸ポリエチレングリコール、ステアリン酸グリコール、ドデシル硫酸ナトリウム、臭化セチルトリアルキルアンモニウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、またはその任意の組み合わせからなる群より選択される、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

ポリマーが、ポリエチレングリコール、アクリル酸ポリマー、メタクリル酸ポリマー、ポリビニルピロリドン、メタクリル酸ブチルおよびメタクリル酸メチルベースのコポリマー、酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニル、エチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシブチルメチルセルロース、キサンタンガム、トラガカント、グアーガム、ロ

ーカストビーンガム、アカシア、アルギン酸塩、酢酸フタル酸セルロース、酢酸酪酸セルロース、フタル酸ヒドロキシプロピルメチルセルロース、またはその任意の組み合わせからなる群より選択される、請求項 1 ～ 8 に記載の組成物。

【請求項 1 0】

アルコールおよびプロピレングリコールのいずれかまたは両方を実質的に含まない、請求項 1 ～ 9 に記載の組成物。

【請求項 1 1】

スプレー後に皮膚適用部位上に閉塞性フィルムを形成しない、請求項 1 ～ 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

噴射剤を含まないスプレー可能局所用医薬組成物であって、約 0 . 0 2 5 重量パーセント～約 0 . 1 重量パーセントのベタメタゾン基剤と等価な量のベタメタゾン化合物と、乳化剤と、ポリマーと、水と、水非混和性物質と、浸透促進剤とを含む、組成物。

【請求項 1 3】

浸透促進剤が、約 0 . 0 0 1 重量パーセント～約 1 5 重量パーセントの量で存在する、請求項 1 2 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

ベタメタゾン化合物が、安息香酸ベタメタゾン、ジプロピオン酸ベタメタゾン、リン酸ベタメタゾンナトリウム、または吉草酸ベタメタゾンである、請求項 1 2 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

アトピー性皮膚炎、脂漏性皮膚炎、湿疹、尋常性乾癬、乾癬性紅皮症 ( e r y t h r o d e r m i c p s o r i a s i s )、頭皮の乾癬、ステロイド反応性皮膚病、紅斑、または接触過敏症反応、および他の関連の疾患または障害の一つ以上を治療するための、請求項 1 ～ 1 4 のいずれかに記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 2 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 5】

本出願の態様は、噴射剤を含まない医薬局所用スプレー可能組成物を調製するプロセスを提供し、

a ) 油性相を得るために、乳化剤と水非混和性物質とを含む混合物を加熱するステップと；

b ) 任意に、抗酸化剤、保存剤、または両方を、a ) の油性相と混合するステップと；

c ) 活性薬剤を浸透促進剤と混合するステップと；

d ) c ) の材料を a ) または b ) の混合物と混合するステップと；

e ) ポリマーを水に溶解するステップと；

f ) 乳濁液を形成するために、d ) の油性相を e ) の水性相と混合するステップとを含む、プロセスを提供する。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

( 項目 1 )

噴射剤を含まないスプレー可能局所用医薬組成物であって、活性薬剤と、乳化剤と、ポリマーと、水と、水非混和性物質と、約 0 . 0 0 1 重量パーセント～約 1 5 重量パーセントの量の活性薬剤皮膚浸透促進剤とを含む、組成物。

( 項目 2 )

浸透促進剤が、約 0 . 0 5 重量パーセント～約 1 0 重量パーセントの量で存在する、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 3 )

浸透促進剤が、約 3 重量パーセント～約 10 重量パーセントの量で存在する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 4)

活性薬剤が、ステロイドである、項目 1 に記載の組成物。

(項目 5)

活性薬剤が、アルクロメタゾン、ベクロメタゾン、ベタメタゾン、フルオシノロン、ハロベタゾール、ヒドロコルチゾン、モメタゾン、トリアムシノロン、クロコルトロン、クロベタゾール、デソキシメタゾン、フルチカゾン、またはその塩またはエステルを含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 6)

活性薬剤が、ジプロピオン酸アルクロメタゾン、ジプロピオン酸ベクロメタゾン、ジプロピオン酸ベタメタゾン、吉草酸ベタメタゾン、フルオシノロンアセトニド、プロピオン酸ハロベタゾール、アセボン酸ヒドロコルチゾン、酢酸ヒドロコルチゾン、吉草酸ヒドロコルチゾン、酪酸ヒドロコルチゾン、フロ酸モメタゾン、トリアムシノロンアセトニド、ピバル酸クロコルトロン、プロピオン酸クロベタゾール、デソキシメタゾン、プロピオン酸フルチカゾンを含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 7)

活性薬剤が、ジプロピオン酸ベタメタゾンである、項目 1 に記載の組成物。

(項目 8)

活性薬剤が、フロ酸モメタゾンである、項目 1 に記載の組成物。

(項目 9)

活性薬剤が、吉草酸ベタメタゾンである、項目 1 に記載の組成物。

(項目 10)

活性薬剤が、トリアムシノロンアセトニドである、項目 1 に記載の組成物。

(項目 11)

活性薬剤が、ジプロピオン酸アルクロメタゾンである、項目 1 に記載の組成物。

(項目 12)

活性薬剤が、約 0.025 重量パーセント～約 0.1 重量パーセントのベタメタゾンと等価な量で存在する、ベタメタゾン化合物である、項目 1 に記載の組成物。

(項目 13)

浸透促進剤が、ポリオール、グリコール、エステル、エーテル、スルホキシド、脂肪酸、脂肪酸エステル、またはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 14)

浸透促進剤が、ポリエチレングリコール、モノラウリン酸ポリエチレングリコール、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、ジメチルスルホキシド、デシルメチルスルホキシド、ラウリン酸、オレイン酸、吉草酸、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、プロピオン酸メチル、オレイン酸エチル、またはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 15)

水非混和性物質が、植物油、飽和パラフィン油、鉱油、脂肪酸、天然脂肪酸の脂肪酸エステル、動物または植物起源のトリグリセリド、中鎖トリグリセリド、モノグリセリド、ジグリセリドおよび/またはトリグリセリドの混合物、ろう、水素化植物油、あるいはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 16)

水非混和性物質が、ヒマシ油、ラノリン油、10～18の炭素原子を有するクエン酸トリイソセチルトリグリセリド、ヤシ油、トウモロコシ油、綿実油、亜麻仁油、ミンク油、オリーブ油、パーム油、ヒマワリ油、堅果油、またはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 17)

水非混和性物質が、鉱油を含む、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 1 8 )

乳化剤が、陽イオン界面活性剤、陰イオン界面活性剤、両性イオン界面活性剤、両性界面活性剤、またはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 1 9 )

乳化剤が、ソルビタン脂肪酸エステル、脂肪酸とソルビトールならびにその一無水物および二無水物との部分エステルの混合物、ステアリン酸ポリエチレングリコール、ステアリン酸グリコール、ドデシル硫酸ナトリウム、臭化セチルトリアルキルアンモニウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、またはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 0 )

ポリマーが、カルボマー、ポリエチレングリコール、アクリル酸ポリマー、メタクリル酸ポリマー、ポリビニルピロリドン、メタクリル酸ブチルおよびメタクリル酸メチルベースのコポリマー、酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニル、セルロース、ガム、アルギン酸塩、酢酸フタル酸セルロース、酢酸酪酸セルロース、フタル酸ヒドロキシプロピルメチルセルロース、またはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 1 )

ポリマーが、エチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシブチルメチルセルロース、またはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 2 )

ポリマーが、キサンタンガム、トラガカント、グアーガム、ローカストビーンガム、アカシア、またはその任意の組み合わせを含む、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 3 )

抗酸化剤、保存剤、湿潤剤、および可塑剤の一つ以上をさらに含む、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 4 )

アルコールおよびプロピレングリコールのいずれかまたは両方を実質的に含まない、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 5 )

実質的に非起泡性である、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 6 )

水性乳濁液である、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 7 )

スプレー後に皮膚適用部位上に閉塞性フィルムを形成しない、項目 1 に記載の組成物。

( 項目 2 8 )

乾癬、ステロイド反応性皮膚病、紅斑、接触過敏症反応、および他の関連する疾患または障害を治療するための、項目 1 ~ 2 7 のいずれかに記載の組成物。

( 項目 2 9 )

アトピー性皮膚炎、脂漏性皮膚炎、湿疹、尋常性乾癬、乾癬性紅皮症 ( e r y t h r o d e r m i c p s o r i a s i s )、および頭皮の乾癬の一つ以上を治療するための、項目 1 ~ 2 7 のいずれかに記載の組成物。

( 項目 3 0 )

噴射剤を含まないスプレー可能局所用医薬組成物であって、約 0 . 0 2 5 重量パーセント ~ 約 0 . 1 重量パーセントのベタメタゾン基剤と等価量のベタメタゾン化合物と、乳化剤と、ポリマーと、水と、水非混和性物質と、約 3 重量パーセント ~ 約 1 0 重量パーセントの量の活性薬剤皮膚浸透促進剤とを含む、組成物。

( 項目 3 1 )

ベタメタゾン化合物が、安息香酸ベタメタゾン、ジプロピオン酸ベタメタゾン、リン酸ベタメタゾンナトリウム、または吉草酸ベタメタゾンである、項目 3 0 に記載の組成物。

( 項目 3 2 )

浸透促進剤が、ジエチレングリコールモノエチルエーテルまたはジエチレングリコールモノメチルエーテルを含む、項目 30 に記載の組成物。

(項目 33)

油中水型乳濁液である、項目 30 に記載の組成物。

(項目 34)

項目 1 または 30 のいずれかに記載の組成物を含む分配用デバイスであり、前記デバイスが、容器と、ポンプディスペンサと、ディップチューブと、絞り弁と、アクチュエータとを含み、前記アクチュエータの運動により、前記組成物が前記ディップチューブを通して前記絞り弁内に流れ、前記組成物が、前記アクチュエータ内のオリフィスからスプレーの形で放出される、デバイス。

(項目 35)

噴射剤を含まない医薬局所用スプレー可能組成物を調製するためのプロセスであって、前記プロセスは：

a) 油性相を得るために、乳化剤と水非混和性物質とを含む混合物を加熱するステップと；

b) 任意に、抗酸化剤、保存剤、または両方を、前記 a) の油性相と混合するステップと；

c) 活性薬剤を浸透促進剤と混合するステップと；

d) 前記 c) の材料を前記 a) または b) の混合物と混合するステップと；

e) ポリマーを水に溶解するステップと；

f) 乳濁液を形成するために、前記 d) の油性相を e) の水性相と混合するステップとを含む、プロセス。