

【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27年3月12日(2015.3.12)

【公表番号】特表2014-528900(P2014-528900A)

【公表日】平成26年10月30日(2014.10.30)

【年通号数】公開・登録公報2014-060

【出願番号】特願2013-551268(P2013-551268)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/107	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 K	39/395	(2006.01)
A 6 1 K	35/74	(2015.01)
A 6 1 K	47/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	27/04	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	9/107	
A 6 1 K	47/14	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	37/02	
A 6 1 K	39/395	D
A 6 1 K	39/395	N
A 6 1 K	35/74	D
A 6 1 K	47/06	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	31/00	

A 6 1 P	35/00
A 6 1 P	1/04
A 6 1 P	27/04
A 6 1 P	19/02
A 6 1 P	1/00
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	21/00
A 6 1 P	25/16
A 6 1 P	11/02
A 6 1 P	15/02
A 6 1 P	15/00
A 6 1 P	15/08
A 6 1 P	27/02
Z N A	

【手続補正書】

【提出日】平成27年1月22日(2015.1.22)

【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】

粒子の集団を含むナノ粒子組成物を含む局所用製剤であって、

前記粒子の大部分が約10～約300ナノメートルの直径を有し、

前記ナノ粒子組成物が少なくとも1つの水性分散媒、少なくとも1つの油、および少なくとも1つの界面活性物質を含み、

前記油が中鎖トリグリセリドであり、

前記界面活性物質がポリソルベートであり、

前記界面活性物質に対する油の比率が約0.5：1～約1：1であり、

前記局所用製剤は、乳化蠅、ミリスチン酸イソプロピル、鉛油、白色ワセリン、ゼラチン、メチルパラベン、プロピルパラベンまたはそれらの任意の組み合わせからなる群から選択される1つ以上の賦形剤をさらに含む、

局所用製剤。

【請求項2】

前記局所用製剤は、乳化蠅、ミリスチン酸イソプロピル、鉛油、白色ワセリン、およびゼラチンをさらに含む、請求項1に記載の局所用製剤。

【請求項3】

前記局所用製剤がパラベンを含まない、請求項1に記載の局所用製剤。

【請求項4】

前記中鎖トリグリセリドが6～12個の炭素原子を含む酸であるか、または13～9オイルである、請求項1に記載の局所用製剤。

【請求項5】

前記ポリソルベートがポリソルベート80である、請求項1に記載の局所用製剤。

【請求項6】

さらに既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤を含み、必要に応じて、前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がタンパク質、タンパク質複合体、抗体またはボツリヌス毒素である、請求項1に記載の局所用製剤。

【請求項7】

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がボツリヌス毒素で

あり、前記ボツリヌス毒素が、A型、A b型、A f型、B型、B f型、C 1型、C 2型、D型、E型、F型およびG型を含む群から選択される、請求項6に記載の局所用製剤。

【請求項8】

前記局所用製剤が薬学的製剤または美容的製剤である、請求項1～7のいずれか一項に記載の局所用製剤。

【請求項9】

前記粒子が皮膚の構造を変質または変化させずに、または皮膚透過促進剤または表皮剥脱物質を使用せずに、皮膚に浸透可能である、請求項8に記載の局所用製剤。

【請求項10】

前記粒子が皮膚透過促進剤または表皮剥脱物質を使用せずに皮膚上層に浸透可能である、請求項7に記載の局所用製剤。

【請求項11】

前記皮膚上層が、

- a) 前記皮膚上層が角質層表面であること、
- b) 前記皮膚上層が真皮孔を含むこと、
- c) 前記皮膚上層が真皮腺を含むこと、または  
それらの任意の組み合わせ

を特徴とする、請求項10に記載の局所用製剤。

【請求項12】

前記ナノ粒子は、-25mV～+25mVの範囲のゼータ電位を有する、請求項1～11のいずれか一項に記載の局所用製剤。

【請求項13】

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤が2～8で保存された場合、長時間にわたり安定なままである、請求項6～12のいずれか一項に記載の局所用製剤。

【請求項14】

前記局所用製剤が、

(i) 脱臭剤、制汗薬、日焼け止め、シャンプー、コンディショナーもしくはそれらの任意の組み合わせとして製剤化されるか、または、

(ii) クリーム、ゲル、リニメント剤、ローション、軟膏、散剤、点滴剤、油、発泡体、スプレー、パッチ、液体、もしくは増粘ローションに製剤化されるか、または、

(iii) 皮膚軟化剤、栄養ローションタイプエマルション、クレンジングローション、クレンジングクリーム、乳液、軟化ローション、マッサージクリーム、軟化クリーム、化粧下地、リップスティック、フェイシャルパック、フェイシャルジェル、シャンプー、リンス、コンディショナー、ボディクレンザー、ヘアトニック、石鹼、およびそれらの任意の組み合わせからなる群から選択される美容用製剤として製剤化される、

請求項7に記載の局所用製剤。

【請求項15】

前記局所用製剤が対象の皮膚に投与され、必要に応じて、

(i) 前記局所用製剤が、

- a) 皮脂腺に関連する状態または障害、
- b) 汗腺に関連する状態または障害、
- c) 毛包に関連する状態または障害、
- d) 皮膚の外層、または

それらの任意の組み合わせ

の処置のために投与されるか、あるいは、

(ii) 前記局所用製剤が、座瘡、多汗症、望ましくない発汗、臭汗症、体臭、色汗症、過剰皮脂産出障害、脂漏症、脂漏性皮膚炎、酒さ、抜け毛、乾癬、真皮感染、ウイルス感染、細菌感染、真菌感染、光線性角化症、湿疹性皮膚炎、アトピー性皮膚炎、熱傷、レノーネ現象、エリテマトーデス、高色素沈着障害、黒皮症、低色素沈着障害、白斑、皮膚

癌、皮膚扁平上皮細胞癌、皮膚基底細胞癌、関節炎、骨関節炎、歯ぎしり、頸痛、乾燥眼、胃腸障害、アカラシア、食道痙攣、胃不全麻痺、オディ括約筋痙攣、裂肛、アニスムス、外側上顆炎、背部痛、腰痛、上背部痛、咬筋肥大、顔面の神経障害、顔面のしわ、額、眉間、顔面および／もしくは眼窓周囲領域に関与するしわ、見苦しい顔面の表情、頸部のしわ、過機能性の顔面のしわ、多動性の顔面のしわ、広頸筋帯、筋痙攣もしくは痙縮に関与する神経筋障害および状態、顔面の麻痺（片側顔面痙攣等）、脳性麻痺、脳卒中による痙縮、眼瞼痙攣、顔面の痙縮、ジストニア、頸部ジストニア、喉頭ジストニア、口下顎ジストニア、書痙、神経痛、三叉神経痛、神経痛、パーキンソン病、足裏の筋膜炎痛、前立腺過形成、頭痛、片頭痛、本態性頭痛、頸椎性頭痛、緊張性頭痛、前立腺障害、前立腺疼痛、前立腺肥大、下肢静止不能症候群、鼻炎、アレルギー性鼻炎、流涎症、皮膚搔痒、斜視、顎関節（「TMJ」）症候群、顔面痙攣、トゥレット症候群、片側顔面痙攣、振戦、本態性振戦、膀胱機能障害、排尿筋・括約筋筋失調、有痛性膀胱、膀胱痙縮、過活動膀胱、腫瘍、痙縮（多発性硬化症に起因するもの等）、後眼窓筋、様々な眼科状態ならびに／またはそれらの組み合わせからなる群から選択される状態または障害の処置のために投与される

ことを特徴とする、請求項1～14のいずれか一項に記載の局所用製剤。

#### 【請求項16】

局所用製剤を製造する方法であって、前記方法は、

i )

(a) 水性分散媒、油、界面活性剤、および必要に応じて既知の治療薬もしくは独立して活性な薬剤を含むプレミックスを提供するステップ、

(b) 鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化蝶、メチルパラベンおよびプロピルパラベンからなる群から選択される1つ以上の賦形剤を含むクリームまたはローション製剤を提供するステップ、および

(c) 生理食塩溶液を提供するステップ、

i i ) 前記(a)、(b)および(c)を合わせて、請求項1～14のいずれか一項に記載の局所用製剤を生成するステップ

を包含し、

必要に応じて前記プレミックス(a)は、プロピルパラベン、メチルパラベン、またはそれらの組み合わせをさらに含み、そして／あるいは、前記クリームまたはローション製剤(b)は、互いに混合した2相を含み、ここで、第1相がメチルパラベンを含み、必要に応じて、第2相が鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化ワックス、およびプロピルパラベンを含み、そして／あるいは、前記生理食塩溶液は、パラベンをさらに含む、

方法。

#### 【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0006

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0006】

一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目1)

粒子の集団を含むナノ粒子組成物であって、

前記粒子の大部分が約10～約300ナノメートルの直径を有し、

前記ナノ粒子組成物が少なくとも1つの水性分散媒、少なくとも1つの油、および少なくとも1つの界面活性物質を含み、

前記油が中鎖トリグリセリドであり、

前記界面活性物質がポリソルベートであり、

前記界面活性物質に対する油の比率が約 0 . 5 : 1 ~ 約 1 : 1 である、ナノ粒子組成物。

(項目 2 )

前記中鎖トリグリセリドが 6 ~ 1 2 個の炭素原子を含む酸である、項目 1 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 3 )

前記中鎖トリグリセリドが 1 3 4 9 オイルである、項目 1 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 4 )

前記ポリソルベートがポリソルベート 8 0 である、項目 1 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 5 )

前記界面活性物質が、超精製ポリソルベート 8 0 である、項目 1 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 6 )

さらに既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤を含む、項目 1 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 7 )

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がタンパク質である、項目 6 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 8 )

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤が抗体である、項目 6 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 9 )

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がタンパク質複合体である、項目 6 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 10 )

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がボツリヌス毒素である、項目 6 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 11 )

前記ボツリヌス毒素が前記粒子内に被包されている、項目 1 0 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 12 )

前記ボツリヌス毒素が前記粒子の表面上に吸着されている、項目 1 0 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 13 )

前記ボツリヌス毒素が前記粒子の界面に会合されている、項目 1 0 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 14 )

前記ボツリヌス毒素が、A 型、A b 型、A f 型、B 型、B f 型、C 1 型、C 2 型、D 型、E 型、F 型および G 型を含む群から選択される、項目 1 0 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 15 )

前記ボツリヌス毒素が A 型ボツリヌス毒素である、項目 1 0 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 16 )

前記粒子が皮膚を変質または変化させずに該皮膚に浸透可能である、項目 1 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 17 )

前記粒子が皮膚透過促進剤または表皮剥脱物質を使用せずに皮膚に浸透可能である、項目 1 に記載のナノ粒子組成物。

(項目 18 )

前記粒子が皮膚透過促進剤または表皮剥脱物質を使用せずに皮膚上層に浸透可能である、項目 1 に記載のナノ粒子組成物。

(項目19)

前記皮膚上層が角質層表面である、項目18に記載のナノ粒子組成物。

(項目20)

前記皮膚上層が真皮孔を含む、項目18に記載のナノ粒子組成物。

(項目21)

前記皮膚上層が真皮腺を含む、項目18に記載のナノ粒子組成物。

(項目22)

前記ナノ粒子組成物がパラベンを含まない、項目1～項目21のいずれか1項に記載のナノ粒子組成物。

(項目23)

メチルパラベン、鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化ワックス、およびプロピルパラベンを含むローション。

(項目24)

さらにポリソルベート80、1349オイル、またはそれらの組み合わせを含む、項目23に記載のローション。

(項目25)

前記ローションが互いに混合した2相を含み、前記第1相がメチルパラベンを含む、項目23に記載のローション。

(項目26)

前記ローションが互いに混合した2相を含み、前記第2相が鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化ワックス、およびプロピルパラベンを含む、項目23に記載のローション。

(項目27)

前記ローションが互いに混合した2相を含み、前記第1相がメチルパラベンを含み、前記第2相が鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化ワックス、およびプロピルパラベンを含む、項目23に記載のローション。

(項目28)

鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、および乳化ワックスを含むローション。

(項目29)

さらにポリソルベート80、1349オイル、またはそれらの組み合わせを含む、項目28に記載のローション。

(項目30)

前記ローションが互いに混合した2相を含み、前記第2相が鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、および乳化ワックスを含む、項目28に記載のローション。

(項目31)

項目23～項目30のいずれか1項に記載のローションおよび既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤を含む医薬組成物。

(項目32)

既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤が、ボツリヌス毒素、抗体、またはそれらの組み合わせである、項目31の医薬組成物。

(項目33)

項目1～項目21のいずれか1項に記載のナノ粒子組成物およびローションを含む医薬組成物。

(項目34)

項目1～項目21のいずれか1項に記載のナノ粒子組成物および項目23～項目30のいずれか1項に記載のローションを含む医薬組成物。

(項目35)

前記医薬組成物が脱臭剤に製剤化される、項目31～項目34のいずれかの医薬組成物。

。

(項目36)

前記医薬組成物が制汗薬に製剤化される、項目31～項目34のいずれかの医薬組成物。

(項目37)

対象を提供するステップと、

項目1～項目21のいずれか1項に記載のナノ粒子組成物、項目23～項目30のいずれか1項に記載のローション、もしくは項目31～項目36のいずれか1項に記載の医薬組成物を前記対象の皮膚に投与するステップと、

を含む方法。

(項目38)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、皮脂腺に関連する状態または障害処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目39)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、汗腺に関連する状態または障害処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目40)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、毛包に関連する状態または障害処置のために投与する、項目33に記載の方法。

(項目41)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、皮膚の外層処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目42)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、座瘡、多汗症、望ましくない発汗、臭汗症、体臭、色汗症、過剰皮脂産出障害、脂漏症、脂漏性皮膚炎、酒さ、抜け毛、乾癬、真皮感染、ウイルス感染、細菌感染、真菌感染、光線性角化症、湿疹性皮膚炎、アトピー性皮膚炎、熱傷、レイノー現象、エリテマトーデス、高色素沈着障害、黒皮症、低色素沈着障害、白斑、皮膚癌、皮膚扁平上皮細胞癌、皮膚基底細胞癌、関節炎、骨關節炎、歯ぎしり、頸痛、乾燥眼、胃腸障害、アカラシア、食道痙攣、胃不全麻痺、オディ括約筋痙攣、裂肛、アニスマス、外側上顆炎、背部痛、腰痛、上背部痛、咬筋肥大、顔面の神経障害、顔面のしわ、額、眉間、顔面および／もしくは眼窩周囲領域に関与するしわ、見苦しい顔面の表情、頸部のしわ、過機能性の顔面のしわ、多動性の顔面のしわ、広頸筋帯、筋痙攣もしくは痙縮に関与する神経筋障害および状態、顔面の麻痺（片側顔面痙攣等）、脳性麻痺、脳卒中による痙縮、眼瞼痙攣、顔面の痙縮、ジストニア、頸部ジストニア、喉頭ジストニア、口下顎ジストニア、書痙、神経痛、三叉神経痛、神経痛、パーキンソン病、足裏の筋膜炎痛、前立腺過形成、頭痛、片頭痛、本態性頭痛、頸椎性頭痛、緊張性頭痛、前立腺障害、前立腺疼痛、前立腺肥大、下肢静止不能症候群、鼻炎、アレルギー性鼻炎、流涎症、皮膚搔痒、斜視、顎関節（「TMJ」）症候群、顔面痙攣、トゥレット症候群、片側顔面痙攣、振戦、本態性振戦、膀胱機能障害、排尿筋・括約筋筋失調、有痛性膀胱、膀胱痙縮、過活動膀胱、腫瘍、痙縮（多発性硬化症に起因するもの等）、後眼窓筋、様々な眼科状態ならびに／またはそれらの組み合わせからなる群から選択される状態または障害処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目43)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を多汗症処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目44)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を望ましくない発汗処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目45)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を臭汗症処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目46)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を体臭処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目47)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を色汗症処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目48)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を座瘡処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目49)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物をしわ処置のために投与する、項目37に記載の方法。

(項目50)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を頭痛処置のために投与する、項目37に記載の方法。

本発明は、本明細書中に記載されるような特定の組成物を提供する。