

【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 19 年 3 月 8 日 (2007.3.8)

【公表番号】特表 2006-520801 (P2006-520801A)

【公表日】平成 18 年 9 月 14 日 (2006.9.14)

【年通号数】公開・登録公報 2006-036

【出願番号】特願 2006-507423 (P2006-507423)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5575 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/4453 (2006.01)

A 6 1 K 31/4458 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/5575

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/4453

A 6 1 K 31/4458

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

A 6 1 P 15/00

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 1 月 19 日 (2007.1.19)

【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】

局所組成物であって：

局所麻酔薬；

ずり減粘性多糖類ガムおよびずり減粘性ポリアクリル酸ポリマーからなる群から選択されるポリマー増粘剤；

脂肪族 $C_1 \sim C_8$ アルコール、脂肪族 $C_8 \sim C_{30}$ エステル、液状ポリオールおよびその混合物からなる群から選択される親油性成分；

水；ならびに

前記組成物の緩衝 pH 値が約 3 ～ 約 7.4 の範囲にあるようにする緩衝系を含む局所組成物。

【請求項 2】

PGE₁、PGA₁、PGB₁、PGF₁、19-ヒドロキシ-PGA₁、19-ヒドロキシ-PGB₁、PGE₂、PGA₂、PGB₂、19-ヒドロキシ-PGA₂、19-ヒドロキシ-PGB₂、PGE₃、PGF₃ およびその混合物からなる群から選択される血管作動性プロスタグランジンを更に含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記血管作動性プロスタグランジンは、プロスタグランジン E₁、プロスタグランジン E₂、その薬剤として許容される塩、その低級アルキルエステルおよびその混合物からなる群から選択される、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記血管作動性プロスタグランジンは約 0.1 mg ~ 約 0.5 mg の量で存在している、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記血管作動性プロスタグランジンは約 0.2 mg ~ 約 0.3 mg の量で存在している、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記局所麻酔薬はリドカイン、ブピバカイン、メピバカイン、ジブカイン、プロピバカイン、エチドカイン、トカイニド、その薬剤として許容される塩およびその混合物からなる群から選択されるアミノアミド局所麻酔薬である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記局所麻酔薬はリドカイン、ブピバカイン、ジクロニン、その薬剤として許容される塩およびその混合物からなる群から選択される局所麻酔薬である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記局所麻酔薬は前記組成物の重量に対して約 0.01 ~ 約 10 重量パーセントである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記ポリマー増粘剤はずり減粘性ポリアクリル酸ポリマーである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記ずり減粘性多糖類ガムはガラクトマンナンガムである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記ずり減粘性多糖類ガムは修飾ガラクトマンナンガムである、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記修飾ガラクトマンナンガムは修飾グアーガムである、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

アルキル-(N-置換アミノ)アルカノエート、アルキル-2-(N,N-二置換アミノ)アルカノエート、(N-置換アミノ)アルカノールアルカノエート、(N,N-二置換アミノ)アルカノールアルカノエート、その薬剤として許容される塩およびその混合物からなる群から選択される浸透増強剤を更に含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記浸透増強剤はドデシル 2-(N,N-ジメチルアミノ)-プロピオネートまたはその薬剤として許容される塩である、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記親油性成分は、モノグリセリド、ジグリセリド、トリグリセリドおよびその混合物からなる群から選択される少なくとも 1 種のグリセリルエステルを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記親油性成分は、グリセリルモノオレエート、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリンおよびその混合物からなる群から選択される少なくとも 1 種のグリセリルエス

テルを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 17】

前記組成物はショ糖エステル、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、長鎖アルコールおよびグリセリルエステルからなる群から選択される乳化剤を更に含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記乳化剤はグリセリルモノオレエート、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリンおよびその混合物からなる群から選択される少なくとも 1 種のグリセリルエステルを含む、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 19】

前記組成物は組成物の総重量に対して最高約 5 パーセントのミルテノールを更に含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記組成物は防腐剤を更に含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記組成物は芳香剤を更に含む、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 22】

そのような治療を必要とする患者において早漏を治療する方法であって：

尿道口に射精潜伏期を延長する量の半固体組成物を投与するステップを含み、前記組成物は

局所麻酔薬；

ずり減粘性多糖類ガムおよびずり減粘性ポリアクリル酸ポリマーからなる群から選択されるポリマー増粘剤；

脂肪族 $C_1 \sim C_8$ アルコール、脂肪族 $C_8 \sim C_{30}$ エステル、液状ポリオールおよびその混合物からなる群から選択される親油性成分；

水；ならびに

前記組成物の緩衝 pH 値が約 3 ～ 約 7.4 の範囲にあるようにする緩衝系を含む方法。

【請求項 23】

前記組成物は、約 0.1 mg から 0.5 mg の量で存在する $PG E_1$ 、 $PG A_1$ 、 $PG B_1$ 、 $PG F_1$ 、19 - ヒドロキシ - $PG A_1$ 、19 - ヒドロキシ - $PG B_1$ 、 $PG E_2$ 、 $PG A_2$ 、 $PG B_2$ 、19 - ヒドロキシ - $PG A_2$ 、19 - ヒドロキシ - $PG B_2$ 、 $PG E_3$ 、 $PG F_3$ およびその混合物からなる群から選択される血管作動性プロスタグランジンを更に含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 24】

血管作動性プロスタグランジンは、プロスタグランジン E_1 、プロスタグランジン E_2 、その薬剤として許容される塩、その低級アルキルエステルおよびその混合物からなる群から選択される、請求項 23 に記載の方法。

【請求項 25】

前記血管作動性プロスタグランジンは約 0.2 mg ～ 約 0.3 mg の量で存在している、請求項 23 に記載の方法。

【請求項 26】

前記局所麻酔薬はリドカイン、ブピバカイン、メピバカイン、ジブカイン、プロピバカイン、エチドカイン、トカイニド、その薬剤として許容される塩およびその混合物からなる群から選択されるアミノアミド局所麻酔薬である、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 27】

前記局所麻酔薬はリドカイン、ブピバカイン、ジクロニン、その薬剤として許容される塩およびその混合物からなる群から選択される局所麻酔薬である、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 28】

前記局所麻酔薬は前記組成物の重量に対して約 0.01 ～ 約 4 重量パーセントである、

請求項 22 に記載の方法。

【請求項 29】

前記ポリマー増粘剤は必ず減粘性ポリアクリル酸ポリマーである、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 30】

前記ポリマーは必ず減粘性多糖類ガムである、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 31】

前記必ず減粘性多糖類ガムはガラクトマンナンガムである、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 32】

前記必ず減粘性多糖類ガムは修飾ガラクトマンナンガムである、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 33】

前記修飾ガラクトマンナンガムは修飾グアーガムである、請求項 32 に記載の方法。

【請求項 34】

前記組成物はアルキル - (N - 置換アミノ) アルカノエート、アルキル - 2 - (N, N - 二置換アミノ) アルカノエート、(N - 置換アミノ) アルカノールアルカノエート、(N, N - 二置換アミノ) アルカノールアルカノエート、その薬剤として許容される塩およびその混合物からなる群から選択される浸透増強剤を更に含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 35】

前記浸透増強剤はドデシル 2 - (N, N - ジメチルアミノ) - プロピオネートまたはその薬剤として許容される塩である、請求項 34 に記載の方法。

【請求項 36】

前記親油性成分は少なくとも 1 つの脂肪族 C₈ ~ C₃₀ エステルを含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 37】

前記親油性成分は、モノグリセリド、ジグリセリド、トリグリセリドおよびその混合物からなる群から選択される少なくとも 1 種のグリセリルエステルを含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 38】

前記親油性成分は、グリセリルモノオレエート、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリンおよびその混合物からなる群から選択される少なくとも 1 種のグリセリルエステルを含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 39】

前記組成物はショ糖エステル、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、長鎖アルコールおよびグリセリルエステルからなる群から選択される乳化剤を更に含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 40】

前記乳化剤はグリセリルモノオレエート、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリンおよびその混合物からなる群から選択される少なくとも 1 種のグリセリルエステルを含む、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 41】

前記組成物は組成物の総重量に対して最高約 5 パーセントのミルテノールを更に含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 42】

前記組成物は防腐剤を更に含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 43】

前記組成物は芳香剤を更に含む、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 44】

早漏を治療するための医薬品を製造するための、請求項 1 から 21 のいずれか一項に記

載の組成物の使用。