

【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2年3月5日(2020.3.5)

【公表番号】特表2019-509330(P2019-509330A)

【公表日】平成31年4月4日(2019.4.4)

【年通号数】公開・登録公報2019-013

【出願番号】特願2018-558113(P2018-558113)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/4174	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/06	(2006.01)
A 6 1 K	9/12	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/20	(2006.01)
A 6 1 K	47/22	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/40	(2006.01)
A 6 1 K	47/06	(2006.01)
A 6 1 K	8/49	(2006.01)
A 6 1 Q	1/10	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/4174	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	9/06	
A 6 1 K	9/12	
A 6 1 K	9/10	
A 6 1 K	9/14	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/20	
A 6 1 K	47/22	
A 6 1 K	47/18	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/14	
A 6 1 K	47/40	
A 6 1 K	47/06	
A 6 1 K	8/49	
A 6 1 Q	1/10	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	27/02	

**【手続補正書】**

【提出日】令和2年1月24日(2020.1.24)

**【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】**

対象の眼の上眼瞼および下眼瞼の垂直方向分離を増加させるための、アルファ-アドレナリン作動薬および透過促進剤を含む皮膚科学的組成物であって、対象の該眼の眼瞼の外表面へ適用されるように用いられることを特徴とし、該アルファ-アドレナリン作動薬は、オキシメタゾリンまたはその塩である、皮膚科学的組成物。

**【請求項2】**

前記組成物の適用前の上眼瞼および下眼瞼の分離と比べて、上眼瞼および下眼瞼の垂直方向分離が、約10パーセントまたはそれ以上増加する、請求項1に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項3】**

対象が下垂症を有さない、請求項1または2に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項4】**

1用量当たり約0.5 μg～4mgのアルファ-アドレナリン作動薬を含む、請求項1～3のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項5】**

透過促進剤が、エタノール、プロピレングリコール、ドデシル-N,N-ジメチル-アミノアセテート、酢酸エチル、アゾン、ドデシル硫酸ナトリウム、d-リモネン、オレイン酸、1,3-ジフェニル尿素、N-メチル-2-ピロリドン、ベータ-シクロデキストリン、ジメチルスルホキシド、およびそれらの任意の組み合わせより選択される、請求項1～4のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項6】**

透過促進剤が、透過促進剤無しでの透過と比べて、アルファ-アドレナリン作動薬の皮膚透過を約2倍またはそれ以上増加させる、請求項1～5のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項7】**

透過促進剤が、透過促進剤無しでの透過と比べて、アルファ-アドレナリン作動薬の皮膚透過を約3倍またはそれ以上増加させる、請求項1～5のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項8】**

透過促進剤が、透過促進剤無しでの透過と比べて、アルファ-アドレナリン作動薬の皮膚透過を約0.5mmまたはそれ以上増加させる、請求項1～5のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項9】**

アルファ-アドレナリン作動薬が、皮膚および中隔脂肪体(septal fat pad)を透過してミュラー筋と接触する、請求項1～8のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項10】**

1種または複数種の化粧用賦形剤をさらに含む、請求項1～9のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項11】**

1種または複数種の化粧用賦形剤が、遮光剤、香料、顔料、および抗酸化剤より選択される、請求項10に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項 1 2】**

皮膚科学的に許容される担体をさらに含む、請求項1～11のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項 1 3】**

皮膚科学的に許容される担体が、ローション、オイル、クリーム、バター、ゲル、軟膏、スプレー、ミルク、およびパウダーより選択される、請求項12に記載の皮膚科学的組成物。

**【請求項 1 4】**

前記組成物の適用前の上眼瞼および下眼瞼の分離と比べて、上眼瞼および下眼瞼の垂直方向分離が、2mmまたはそれ以上増加する、請求項1～13のいずれか一項に記載の皮膚科学的組成物。

**【手続補正 2】**

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0018】

[本発明1001]

皮膚科学的に許容される担体、ミュラー筋を刺激する薬剤、および少なくとも1種類の化粧用賦形剤を含む、アイシャドー状組成物。

[本発明1002]

ミュラー筋を刺激する薬剤が、アルファ-アドレナリン作動薬を含む、本発明1001のアイシャドー状組成物。

[本発明1003]

アルファ-アドレナリン作動薬が、天然アルファ-アドレナリン作動薬または合成アルファ-アドレナリン作動薬より選択される、本発明1002のアイシャドー状組成物。

[本発明1004]

アルファ-アドレナリン作動薬が、アルファ-1アゴニストおよびアルファ-2アゴニストより選択される、本発明1003のアイシャドー状組成物。

[本発明1005]

アルファ-アドレナリン作動薬が、アミデフリン、アニソダミン、アニソジン、クロロエチルクロニジン、シラゾリン、デスペンラファキシン、ジピベフリン、ドーパミン、エフェドリン、エピネフリン(アドレナリン)、エチレフリン、エチルノルエピネフリン、5-フルオロノルエピネフリン、6-フルオロノルエピネフリン、インダニジン、レボノルデフリン、メタラミノール、メトキサミン、メチルドーバ、ミドドリン、ナファゾリン、ノルエピネフリン(ノルアドレナリン)、オクトパミン、オキシメタゾリン、フェニレフリン、フェニルプロパノールアミン、プロソイドエフェドリン、シネフリン、テトラヒドロゾリン、キシロメタゾリン、6-(5-フルオロ-2-ピリミジン-5-イル-フェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ[1,2-a]イミダゾール、A-61603(N-[5-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)-2-ヒドロキシ-5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル]メタンスルホンアミド)、それらのいずれか1つの塩、およびそれらの任意の組み合わせより選択される、本発明1004のアイシャドー状組成物。

[本発明1006]

アルファ-アドレナリン作動薬が、オキシメタゾリンまたはその塩である、本発明1005のアイシャドー状組成物。

[本発明1007]

アルファ-アドレナリン作動薬がオキシメタゾリンである、本発明1006のアイシャドー状組成物。

[本発明1008]

アルファ-アドレナリン作動薬がオキシメタゾリンではない、本発明1002～1005のいず

れかのアイシャドー状組成物。

[本発明1009]

皮膚科学的に許容される担体が、ローション、オイル、クリーム、バター、ゲル、軟膏、スプレー、ミルク、およびパウダーより選択される、本発明1001～1008のいずれかのアイシャドー状組成物。

[本発明1010]

皮膚科学的に許容される担体がパウダーである、本発明1009のアイシャドー状組成物。

[本発明1011]

化粧用賦形剤が、遮光剤、香料、顔料、および抗酸化剤より選択される、本発明1001～1010のいずれかのアイシャドー状組成物。

[本発明1012]

皮膚科学的に許容される担体、アルファ-アドレナリン作動薬、および少なくとも1種類の透過促進剤を含む、皮膚科学的組成物。

[本発明1013]

透過促進剤が、アルファ-アドレナリン作動薬の皮膚透過を約2倍またはそれ以上増加させる、本発明1012の皮膚科学的組成物。

[本発明1014]

透過促進剤が、アルファ-アドレナリン作動薬の皮膚透過を約3倍またはそれ以上増加させる、本発明1013の皮膚科学的組成物。

[本発明1015]

透過促進剤が、アルファ-アドレナリン作動薬の皮膚透過を約0.5mmまたはそれ以上増加させる、本発明1012の皮膚科学的組成物。

[本発明1016]

透過促進剤が、アルファ-アドレナリン作動薬の皮膚透過を約1.0mmまたはそれ以上増加させる、本発明1015の皮膚科学的組成物。

[本発明1017]

アルファ-アドレナリン作動薬が、皮膚および中隔脂肪体(septal fat pad)を透過してミュラー筋と接触する、本発明1012～1016のいずれかの皮膚科学的組成物。

[本発明1018]

透過促進剤が、アルコール、スルホキシド、アゾン、ピロリドン、尿素、アルキル-N,N-二置換アミノアセタール、プロピレングリコール、界面活性剤、テルペン、テルペノイド、脂肪酸、エステル、シクロデキストリン、およびそれらの任意の組み合わせより選択される、本発明1012～1017のいずれかの皮膚科学的組成物。

[本発明1019]

透過促進剤が、エタノール、プロピレングリコール、ドデシル-N,N-ジメチル-アミノアセテート、酢酸エチル、アゾン、ドデシル硫酸ナトリウム、d-リモネン、オレイン酸、1,3-ジフェニル尿素、N-メチル-2-ピロリドン、ベータ-シクロデキストリン、ジメチルスルホキシド、およびそれらの任意の組み合わせより選択される、本発明1018の皮膚科学的組成物。

[本発明1020]

1種または複数種の化粧用賦形剤をさらに含む、本発明1012～1019のいずれかの皮膚科学的組成物。

[本発明1021]

皮膚科学的に許容される担体と、アルファ-アドレナリン作動薬と、遮光剤、香料、顔料、および抗酸化剤より選択される少なくとも1種類の化粧用賦形剤とを含む、皮膚科学的組成物。

[本発明1022]

皮膚科学的に許容される担体が、ローション、オイル、クリーム、バター、ゲル、軟膏、スプレー、ミルク、およびパウダーより選択される、本発明1012～1021のいずれかの皮膚科学的組成物。

[本発明1023]

アルファ-アドレナリン作動薬が、天然アルファ-アドレナリン作動薬または合成アルファ-アドレナリン作動薬より選択される、本発明1012～1022のいずれかの皮膚科学的組成物。

[本発明1024]

アルファ-アドレナリン作動薬が、アルファ-1アゴニストおよびアルファ-2アゴニストより選択される、本発明1023の皮膚科学的組成物。

[本発明1025]

アルファ-アドレナリン作動薬が、アミデフリン、アニソダミン、アニソジン、クロロエチルクロニジン、シラゾリン、デスベンラファキシン、ジピベフリン、ドーパミン、エフェドリン、エピネフリン（アドレナリン）、エチレフリン、エチルノルエピネフリン、5-フルオロノルエピネフリン、6-フルオロノルエピネフリン、インダニジン、レボノルデフリン、メタラミノール、メトキサミン、メチルドーバ、ミドドリン、ナファゾリン、ノルエピネフリン（ノルアドレナリン）、オクトパミン、オキシメタゾリン、フェニレフリン、フェニルプロパノールアミン、プロソイドエフェドリン、シネフリン、テトラヒドロゾリン、キシロメタゾリン、6-(5-フルオロ-2-ピリミジン-5-イル-フェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ[1,2-a]イミダゾール、A-61603 (N-[5-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)-2-ヒドロキシ-5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル]メタンスルホンアミド)、それらのいずれか1つの塩、およびそれらの任意の組み合わせより選択される、本発明1012～1024のいずれかの皮膚科学的組成物。

[本発明1026]

アルファ-アドレナリン作動薬が、オキシメタゾリンまたはその塩である、本発明1025の皮膚科学的組成物。

[本発明1027]

アルファ-アドレナリン作動薬がオキシメタゾリンである、本発明1026の皮膚科学的組成物。

[本発明1028]

アルファ-アドレナリン作動薬がオキシメタゾリンではない、本発明1012～1027のいずれかの皮膚科学的組成物。

[本発明1029]

1用量当たり約0.5 μg～4mgのアルファ-アドレナリン作動薬を含む、本発明1012～1028のいずれかの皮膚科学的組成物。

[本発明1030]

1用量当たり約0.5 μg～2mgのアルファ-アドレナリン作動薬を含む、本発明1029の皮膚科学的組成物。

[本発明1031]

アルファ-アドレナリン作動薬と、アルファ-アドレナリン作動薬の放出を制御する送達システムとを含む、制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1032]

持続放出組成物、長期放出組成物、パルス放出組成物、および遅延放出組成物より選択される、本発明1031の制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1033]

送達システムが、ポリマーベースのシステム、多孔性マトリックス、ヒドロゲル放出システム、ペプチドベースのシステム、およびそれらの任意の組み合わせより選択される、本発明1031または1032の制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1034]

持続放出組成物である、本発明1031～1033のいずれかの制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1035]

眼瞼の外表面への投与用に製剤化されている、本発明1031～1034のいずれかの制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1036]

1用量当たり約0.2μg～約6mgのアルファ-アドレナリン作動薬を含む、本発明1031～1035のいずれかの制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1037]

1用量当たり約0.5μg～約4mgのアルファ-アドレナリン作動薬を含む、本発明1036の制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1038]

1用量当たり約0.5μg～約3mgのアルファ-アドレナリン作動薬を含む、本発明1037の制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1039]

ローション、クリーム、バター、ゲル、軟膏、スプレー、ミルク、またはパウダーとして製剤化されている、本発明1031～1038のいずれかの制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1040]

少なくとも1種類の皮膚科学的に許容される担体をさらに含む、本発明1031～1039のいずれかの制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1041]

遮光剤、香料、顔料、および抗酸化剤より選択される1種または複数種の化粧用賦形剤をさらに含む、本発明1040の制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1042]

アルファ-アドレナリン作動薬が、天然アルファ-アドレナリン作動薬または合成アルファ-アドレナリン作動薬より選択される、本発明1031～1041のいずれかの制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1043]

アルファ-アドレナリン作動薬が、アルファ-1アゴニストおよびアルファ-2アゴニストより選択される、本発明1042の制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1044]

アルファ-アドレナリン作動薬が、アミデフリン、アニソダミン、アニソジン、クロロエチルクロニジン、シラゾリン、デスペンラファキシン、ジピベフリン、ドーパミン、エフェドリン、エピネフリン(アドレナリン)、エチレフリン、エチルノルエピネフリン、5-フルオロノルエピネフリン、6-フルオロノルエピネフリン、インダニジン、レボノルデフリン、メタラミノール、メトキサミン、メチルドーバ、ミドドリン、ナファゾリン、ノルエピネフリン(ノルアドレナリン)、オクトパミン、オキシメタゾリン、フェニレフリン、フェニルプロパノールアミン、プロソイドエフェドリン、シネフリン、テトラヒドロゾリン、キシロメタゾリン、6-(5-フルオロ-2-ピリミジン-5-イル-フェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-ピロ[1,2-a]イミダゾール、A-61603(N-[5-(4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-2-イル)-2-ヒドロキシ-5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル]メタンスルホンアミド)、それらのいずれか1つの塩、およびそれらの任意の組み合わせより選択される、本発明1031～1043のいずれかの制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1045]

アルファ-アドレナリン作動薬が、オキシメタゾリンまたはその塩である、本発明1044の制御放出型皮膚科学的組成物。

[本発明1046]

その必要がある対象の眼の下垂症を治療するための方法であって、アルファ-アドレナリン作動薬を含む組成物を対象の該眼の眼瞼の外表面へ投与する工程を含む、方法。

[本発明1047]

組成物を1日あたり1回、2回または3回投与する、本発明1046の方法。

[本発明1048]

組成物を2日毎に投与する、本発明1046の方法。

[本発明1049]

組成物を3日毎に投与する、本発明1046の方法。

[本発明1050]

組成物が、本発明1001～1045のいずれか1つより選択される、本発明1046～1049のいずれかの方法。

[本発明1051]

対象の眼の美容療法のための方法であって、アルファ-アドレナリン作動薬を含む組成物を対象の該眼の眼瞼の外表面へ投与する工程を含む、方法。

[本発明1052]

組成物を1日あたり1回、2回または3回投与する、本発明1051の方法。

[本発明1053]

組成物を2日毎に投与する、本発明1051の方法。

[本発明1054]

組成物を3日毎に投与する、本発明1051の方法。

[本発明1055]

組成物が、本発明1001～1045のいずれか1つより選択される、本発明1051～1054のいずれかの方法。

[本発明1056]

対象の眼の上眼瞼および下眼瞼の垂直方向分離を増加させるための方法であって、有効量のアルファ-アドレナリン作動薬を含む組成物を対象の該眼の眼瞼の外表面へ投与する工程を含む、方法。

[本発明1057]

前記投与前の上眼瞼および下眼瞼の分離と比べて、上眼瞼および下眼瞼の垂直方向分離を約10パーセントまたはそれ以上増加させる、本発明1056の方法。

[本発明1058]

組成物が、本発明1001～1045のいずれか1つより選択される、本発明1056または1057の方法。

[本発明1059]

対象が下垂症を有さない、本発明1051～1058のいずれかの方法。

[本発明1060]

組成物を眼球へ投与しない、本発明1051～1059のいずれかの方法。

参照による組み入れ

本明細書において言及される全ての刊行物、特許、および特許出願は、各個々の刊行物、特許、または特許出願が、参照により組み入れられるように具体的かつ個々に示されたものと同じ程度に、参照により本明細書に組み入れられる。