

【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5年2月17日(2023.2.17)

【公開番号】特開2022-88646(P2022-88646A)

【公開日】令和4年6月14日(2022.6.14)

【年通号数】公開公報(特許)2022-106

【出願番号】特願2022-63361(P2022-63361)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/06(2006.01)

10

A 6 1 K 31/568(2006.01)

A 6 1 K 47/10(2017.01)

A 6 1 K 9/10(2006.01)

A 6 1 K 47/14(2017.01)

A 6 1 K 47/32(2006.01)

A 6 1 K 47/34(2017.01)

A 6 1 K 47/38(2006.01)

A 6 1 P 5/24(2006.01)

A 6 1 P 15/00(2006.01)

A 6 1 P 15/12(2006.01)

20

A 6 1 P 17/00(2006.01)

A 6 1 P 19/02(2006.01)

A 6 1 P 25/06(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 38/22(2006.01)

A 6 1 K 31/4458(2006.01)

A 6 1 K 31/56(2006.01)

A 6 1 K 31/566(2006.01)

A 6 1 K 31/57(2006.01)

30

A 6 1 K 31/58(2006.01)

A 6 1 K 31/616(2006.01)

A 6 1 K 31/137(2006.01)

A 6 1 K 31/18(2006.01)

A 6 1 K 31/192(2006.01)

A 6 1 K 31/195(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 31/568

A 6 1 K 47/10

40

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 19/02

50

A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 43/00
A 6 1 K 38/22
A 6 1 K 31/4458
A 6 1 K 31/56
A 6 1 K 31/566
A 6 1 K 31/57
A 6 1 K 31/58
A 6 1 K 31/616
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 K 31/137
A 6 1 K 31/18
A 6 1 K 31/192
A 6 1 K 31/195

10

【手続補正書】

【提出日】令和5年2月9日(2023.2.9)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

20

【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】

安定したゲル組成物であって、

(a) 微粒子化されている少なくとも1つの活性成分またはその塩と；

(b) (i) 少なくとも1つの油性作用物質；および

(ii) 少なくとも1つの脂溶性セルロースポリマー

を含む、少なくとも1つのオレオゲルと；

30

(c) 少なくとも1つの水性ゲルと；

(d) 前記水性ゲルの少なくとも一部に分散されている生体接着剤と；

(e) 前記安定したゲル組成物の総重量の最大4重量%を構成するC₁－C₈アルコールと

を含む、安定したゲル組成物。

【請求項2】

前記少なくとも1つの活性成分は、微粒子化されたテストステロンもしくはその塩、微粒子化されたエストラジオールもしくはその塩、微粒子化されたダナゾールもしくはその塩、または微粒子化されたジクロフェナクもしくはその塩である、請求項1に記載の安定したゲル組成物。

40

【請求項3】

前記少なくとも1つの油性作用物質が、前記安定したゲル組成物の総重量の5重量%から40重量%を構成する、請求項1に記載の安定したゲル組成物。

【請求項4】

前記油性作用物質が、合成ジグリセリド、合成トリグリセリド、プロピレングリコールイソステアレート、ポリオキシエチレン化オレイン酸グリセリド混合物、植物起源の油、およびそれら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に記載の安定したゲル組成物。

【請求項5】

前記少なくとも1つの脂溶性セルロースポリマーが、前記安定したゲル組成物の総重量の

50

1 重量% から 10 重量% を構成する、請求項 1 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 6】

前記 1 つの脂溶性セルロースポリマーがアルキルセルロースである、請求項 1 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 7】

前記アルキルセルロースは、メチルセルロース、エチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロースおよびそれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項 6 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 8】

前記水性ゲルは、カルボマー、ポロキサマー、カルボキシメチルセルロースナトリウムおよびこれらの混合物からなる群より選択される少なくとも 1 つのゲル化剤をさらに含む、請求項 1 に記載の安定したゲル組成物。

10

【請求項 9】

前記生体接着剤は、モノオレイン酸グリセリル、ポリカルボフィル、またはそれらの塩を含む、請求項 1 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 10】

前記少なくとも 1 つの活性成分が、前記水性ゲルの少なくとも一部に分散されている、請求項 1 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 11】

前記生体接着剤は、乳化することによって前記安定したゲル組成物に製剤化されている、請求項 1 に記載の安定したゲル組成物。

20

【請求項 12】

被験体における疾患または状態を少なくとも部分的に改善するための請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の安定したゲル組成物であって、治療有効量の前記安定したゲル組成物が前記被験体に投与されることを特徴とする、安定したゲル組成物。

【請求項 13】

前記投与することが、前記安定したゲル組成物を前記被験体に経膈投与することである、請求項 12 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 14】

前記被験体の皮膚における前記活性成分の浸透を増加させるのに十分な量の浸透促進剤を含み、他の点では同一の組成物と比べて、前記経膈投与することが、膈集塊物を減少させる、請求項 13 に記載の安定したゲル組成物。

30

【請求項 15】

前記投与することが、前記安定したゲル組成物を、前記被験体の皮膚の少なくとも一部に適用することを含む、請求項 12 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 16】

前記安定したゲル組成物の、前記被験体の皮膚の一部への適用は、前記被験体の角質層に前記活性成分のレザバーを提供する、請求項 15 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 17】

前記レザバーは、前記被験体の血清への前記活性成分の約零次の放出速度プロファイルを提供する、請求項 16 に記載の安定したゲル組成物。

40

【請求項 18】

前記被験体の皮膚における前記活性成分の浸透を増加させるのに十分な量の浸透促進剤を含み、他の点では同一の組成物と比べて、前記投与することが、前記被験体の血清中への前記安定したゲル組成物の吸収を増加させる、請求項 12 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 19】

前記疾患または状態は、ホルモンの不均衡、閉経、子宮内膜症、がん、皮膚乾燥、関節炎、片頭痛、またはそれら任意の組み合わせである、請求項 12 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 20】

50

前記ホルモンの不均衡が、低テストステロン、低プロゲステロン、または低エストロゲンである、請求項 19 に記載の安定したゲル組成物。

【請求項 21】

安定したゲル組成物を調製する方法であって、

(a) 微粒子化された活性作用物質またはその塩を、水性ゲルの少なくとも一部に分散させる工程；

(b) 前記 (a) の分散液を、少なくとも 1 つのオレオゲルと接触させて、安定したゲル組成物を形成する工程

を含み、ここで、前記少なくとも 1 つのオレオゲルは、少なくとも 1 つの油性作用物質および少なくとも 1 つの脂溶性セルロースポリマーを含み、それによって安定したゲル組成物を調製する、

10

方法。

【請求項 22】

前記方法が、前記水性ゲル中に生体接着剤を乳化することをさらに含む、請求項 21 に記載の方法。

【請求項 23】

前記生体接着剤は、ポリカルボフィルである、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 24】

前記微粒子化された活性作用物質は、微粒子化されたエストラジオールもしくはその塩、微粒子化されたダナゾールもしくはその塩、および微粒子化されたジクロフェナクもしくはその塩からなる群から選択される、請求項 21 に記載の方法。

20

【請求項 25】

請求項 21 から 24 のいずれか一項の方法により作製された安定したゲル組成物。

30

40

50