

【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28年12月8日 (2016.12.8)

【公表番号】特表2016-510807(P2016-510807A)

【公表日】平成28年4月11日 (2016.4.11)

【年通号数】公開・登録公報2016-022

【出願番号】特願2015-562408(P2015-562408)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/107

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/10

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 K 31/137

【手続補正書】

【提出日】平成28年10月20日 (2016.10.20)

【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】

少なくとも 1 種の軟性フィルム形成成分；

少なくとも 1 種の界面活性剤；

少なくとも 15 % (w / w) の水；

少なくとも 1 種の非極性揮発性シロキサン溶媒；および

プラモキシシ、フェニレフリン、ヒドロコルチゾン、サリチル酸、ニトログリセリン、シルデナフィル、ニフェジピン、ベラパミル、ジルチアゼム、プロカイン、リドカイン、テトラカイン、ジブカイン、プリロカイン、フェナカイン、ベンジルアルコール、ベンゾカ

イン、ジペロドン、ジクロニン、ジメチソキン、エピネフリン、塩酸テトラヒドロゾリン、アンフェタミン類、抗ヒスタミン類、メチルフェニデート、メフェドロン、オキシメタゾリン、シュードエフェドリン、シロシビン、硫酸エフェドリン、イミキモド、ポドフィリン、ポドフィロトキシン、フルオロウラシル、シネカテキンス、植物抽出物、アダパレン、過酸化ベンゾイル、タザロテン、アゼライン酸、クリンダマイシン、アシクロビル、ペンシクロビル、ファミシクロビル、ドコサノールまたはそれらの塩およびそれらの組み合わせからなる群から選択される治療に有効な濃度の少なくとも1種の薬物を含む局所組成物であって、ここで、該組成物は体表面への適用後60秒以内に乾燥し、乾燥組成物を形成するように適切に設計されており、該乾燥組成物が

(i) 体表面の不規則性および体表面の動作に密接に順応する軟性フィルムであり、  
(ii) 12時間を超えてひび割れまたは剥離を起こさず、不変のままであり、長期間に亘り薬物を放出する耐久性フィルムを形成する、  
局所組成物。

【請求項2】

実質的に非疼痛性である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

少なくとも1種のフィルム形成成分がシロキシケイ酸、シルセスキオキサンおよびこれらの組み合わせからなる群から選択されるシリコーン樹脂である、請求項1 または2に記載の組成物。

【請求項4】

ゲルの形態である、請求項1 ～3のいずれかに記載の組成物。

【請求項5】

水中油型エマルジョンの形態である、請求項1 ～3のいずれかに記載の組成物。

【請求項6】

少なくとも1種の界面活性剤がポリソルベートである、請求項1 ～5のいずれかに記載の組成物。

【請求項7】

ポリソルベートがポリオキシエチレンソルビタンモノオレアートである、請求項6に記載の組成物。

【請求項8】

さらにジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマー、シリコーンガムブレンドからなる群から選択される添加剤を含む、ゲル化剤およびこれらの組み合わせ、請求項1 ～7のいずれかに記載の組成物。

【請求項9】

15% (w/w) ～ 40% (w/w)の水を含む、請求項1 ～8のいずれかに記載の組成物。

【請求項10】

さらに組成物のpHを4.2 ～ 4.4のpHに調節するための緩衝液を含む、請求項1 ～9のいずれかに記載の組成物。

【請求項11】

さらに有機ケイ素界面活性剤を含む、請求項1 ～10のいずれかに記載の組成物。

【請求項12】

有機ケイ素界面活性剤がセチルジメチコンコポリオールである、請求項11に記載の組成物。

【請求項13】

さらに粘度調整剤を含む、請求項1 ～12のいずれかに記載の組成物。

【請求項14】

15.0% (w/w) ～ 25.0% (w/w)のトリメチルシロキシケイ酸；  
1.0% (w/w) ～ 5.0% (w/w)のポリオキシエチレンソルビタンモノオレアート；および

30.0% (w/w) ~ 50.0% (w/w) の非極性揮発性シロキサン溶媒を含む、  
請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 15】

局所障害の処置のために 1 日 1 回体表面に局所適用する、請求項 1 ~ 14 のいずれかに  
記載の組成物。

【請求項 16】

局所障害の処置のために 2 日に 1 回体表面に局所適用する、請求項 1 ~ 14 のいずれか  
に記載の組成物。

【請求項 17】

局所障害の処置のために週に 2 回体表面に局所適用する、請求項 1 ~ 14 のいずれかに  
記載の組成物。

【請求項 18】

該組成物の局所適用後一定時間後、1 日数回適用する同一成分を同一濃度で含む市販の  
組成物で観察されるものと同等またはそれより良好な治療効果が観察可能である、請求項  
15 ~ 17 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 19】

局所障害が痔、裂肛、肛門亀裂、痔瘻、肛門膿瘍および肛門掻痒症からなる群から選択  
される、請求項 15 ~ 18 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 20】

局所障害が性器疣贅または肛門疣贅である、請求項 15 ~ 18 のいずれかに記載の組成  
物。

【請求項 21】

局所障害が疱疹である、請求項 15 ~ 18 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 22】

局所障害がアクネまたは酒さである、請求項 15 ~ 18 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 23】

請求項 1 ~ 22 のいずれかに記載の組成物および保存および組成物の体表面への適用に  
適する容器 - アプリケーターデバイスを含む、キット。

【請求項 24】

容器 - アプリケーターデバイスが使い捨てワイプ、シリンジ、ドロPPER、スプレーデ  
ィスペンサー、圧縮性ボトルまたはチューブ、スパーテル、坐薬挿入チューブ、突出チュ  
ーブおよび可膨張性メンバーからなる群から選択される、請求項 23 に記載のキット。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0004】

ここに説明する面によって、少なくとも 1 種のフィルム形成成分；少なくとも 1 種の界  
面活性剤；少なくとも 15% (w/w) 水；少なくとも 1 種の非極性揮発性シロキサン溶媒  
；および治療に有効な濃度の少なくとも 1 種の薬物を含む局所組成物を提供し、ここで、  
該組成物は体表面への適用後 60 秒以内に乾燥し、乾燥組成物を形成するように適切に設  
計されており、該乾燥組成物は、体表面の不規則性および体表面の動作に密接に順応する  
軟性フィルムであり、(ii) 12 時間を超えてひび割れまたは剥離を起こさず、不変のまま  
であり、長期間に亘って薬物を放出する耐久性フィルムを形成する。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0055

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【 0 0 5 5 】

なおさらなる態様において、局所組成物は、(i)約20%(w/w)のトリメチルシロキシケイ酸；(ii)約1.5%(w/w)のTween 80；(iii)約4%(w/w)のセチルPEG/PPG-10/1ジメチコン、(iv)約24%(w/w)のヘキサメチルジシロキサンおよび20%(w/w)のイソオクタン；(v)約30%(w/w)の水；および(vi)薬物としての約1%(w/w)プラモキシンを含む。あるいは、薬物は約0.25%(w/w)の量のフェニレフリンである。さらに別に、薬物は約1%(w/w)プラモキシんと約0.25%(w/w)フェニレフリンの組み合わせである。なおさらに別に、薬物は約1%(w/w)の量のヒドロコルチゾンまたは約1.0%(w/w)～約20%(w/w)の量のサリチル酸または約0.2%(w/w)～約0.5%(w/w)の量のニトログリセリンまたは約10%(w/w)の量のクエン酸シルデナフィルまたは約0.1%(w/w)～約5.0%(w/w)の量のニフェジピン約0.1%(w/w)～約5.0%(w/w)の量のジルチアゼムまたは約0.1%(w/w)～約5.0%(w/w)の量のベラパミルまたはこれらの組み合わせである。

## 【 手 続 補 正 4 】

【 補 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 補 正 対 象 項 目 名 】 0 1 8 5

【 補 正 方 法 】 変 更

【 補 正 の 内 容 】

## 【 0 1 8 5 】

一つの態様において、本発明の局所組成物は、(i)約15%(w/w)トリメチルシロキシケイ酸；(ii)約1.5%(w/w)ラウリル硫酸ナトリウム；(iii)約4%(w/w)セチルPEG/PPG-10/1ジメチコン；(iv)約22%(w/w)ヘキサメチルジシロキサンおよび21%(w/w)イソオクタン；(v)約25%(w/w)水；(vi)約1%(w/w)プラモキシン；(vii)約0.25%(w/w)フェニレフリン；(viii)約5%(w/w)ビス-ビニルジメチコンおよび5%(w/w)ビニルジメチコンおよびハイドロゲンジメチコン；および(ix)約1%(w/w)シクロペンタシロキサンおよびジメチコノールを含む。

## 【 手 続 補 正 5 】

【 補 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 補 正 対 象 項 目 名 】 0 1 9 5

【 補 正 方 法 】 変 更

【 補 正 の 内 容 】

## 【 0 1 9 5 】

容器 - アプリケーターはさらに2個の部分を含み得る。(1)組成物を保持し、空気、水および混入物から守る保存領域またはリザーバー；および(2)一般に肛門および/または直腸粘膜への組成物の適用において助けとなるように設計された特殊な形状のチップを含むアプリケーター。具体的態様において、アプリケーターは、容器に欠かせない要素、例えば、リザーバーから伸びる細長い挿入チューブである。あるいは、保存領域およびアプリケーターは、チューブリザーバーと、別に供給されるドロッパーのような別々の要素であり得る。さらに他の態様において、容器およびアプリケーターは、例えば、それぞれ容器とアプリケーターに備えられたまたは配置が逆である適合性の雄型および雌型コネクターにより、使用中に連結される別々の要素として供給され得る。

## 【 手 続 補 正 6 】

【 補 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 補 正 対 象 項 目 名 】 0 2 4 0

【 補 正 方 法 】 変 更

【 補 正 の 内 容 】

## 【 0 2 4 0 】

ここに引用する全ての特許、特許出願および刊行物は、引用によりその全体を本明細書に包含させる。上記のおよび他の特色および機能またはその代替物を、多くの他の異なる系または適用と好ましく組み合わせ得ることは認識される。種々の現在予測されないまた

は予期されない代替物、修飾、変化または改善が、この後当業者によりなされ得る。

本発明は、さらに次の態様を含む。

1. 少なくとも1種の軟性フィルム形成成分；

少なくとも1種の界面活性剤；

少なくとも15% (w/w)の水；

少なくとも1種の高極性揮発性シロキサン溶媒；および

プラモキシム、フェニレフリン、ヒドロコルチゾン、サリチル酸、ニトログリセリン、シルデナフィル、ニフェジピン、ベラパミル、ジルチアゼム、プロカイン、リドカイン、テトラカイン、ジブカイン、プリロカイン、フェナカイン、ベンジルアルコール、ベンゾカイン、ジペロドン、ジクロニン、ジメチソキン、エピネフリン、塩酸テトラヒドロゾリン、アンフェタミン類、抗ヒスタミン類、メチルフェニデート、メフェドロン、オキシメタゾリン、シュードエフェドリン、シロシピン、硫酸エフェドリン、イミキモド、ポドフィリン、ポドフィロトキシム、フルオロウラシル、シネカテキンス、植物抽出物、アダパレン、過酸化ベンゾイル、タザロテン、アゼライン酸、クリンダマイシン、アシクロビル、ペンシクロビル、ファムシクロビル、ドコサノールまたはそれらの塩およびそれらの組み合わせからなる群から選択される治療に有効な濃度の少なくとも1種の薬物を含む局所組成物であって、ここで、該組成物は体表面への適用後60秒以内に乾燥し、乾燥組成物を形成するように適切に設計されており、該乾燥組成物が

(i) 体表面の不規則性および体表面の動作に密接に順応する軟性フィルムであり、

(ii) 12時間を超えてひび割れまたは剥離を起こさず、不変のままであり、長期間に亘り薬物を放出する耐久性フィルムを形成する、局所組成物。

2. 実質的に非刺激性である、項1に記載の組成物。

3. 少なくとも1種のフィルム形成成分がシロキシケイ酸、シルセスキオキサンおよびこれらの組み合わせからなる群から選択されるシリコン樹脂である、項1に記載の組成物。

4. ゲルの形態である、項1に記載の組成物。

5. 水中油型エマルジョンの形態である、項1に記載の組成物。

6. 少なくとも1種の界面活性剤がポリソルベートである、項1に記載の組成物。

7. ポリソルベートがポリオキシエチレンソルビタンモノオレアートである、項6に記載の組成物。

8. さらにジメチコン/ビニルジメチコンクロスポリマー、シリコンガムブレンドからなる群から選択される添加剤を含む、ゲル化剤およびこれらの組み合わせ、項1に記載の組成物。

9. 約15% (w/w) ~ 約40% (w/w)の水を含む、項1に記載の組成物。

10. さらに組成物のpHを約4.2 ~ 4.4のpHに調節するための緩衝液を含む、項1に記載の組成物。

11. さらに有機ケイ素界面活性剤を含む、項1に記載の組成物。

12. 有機ケイ素界面活性剤がセチルジメチコンコポリオールである、項11に記載の組成物。

13. さらに粘度調整剤を含む、項1に記載の組成物。

14. 約15.0% (w/w) ~ 約25.0% (w/w)のトリメチルシロキシケイ酸；

約1.0% (w/w) ~ 約5.0% (w/w)のポリオキシエチレンソルビタンモノオレアート；および

約30.0% (w/w) ~ 約50.0% (w/w)の高極性揮発性シロキサン溶媒を含む、項1に記載の組成物。

15. 処置を必要とする対象の体表面に治療有効量の項1に記載の組成物を1日1回局所適用することを含む、局所障害の処置方法。

16. 該組成物の局所適用後一定時間後、1日数回適用する同一成分を同一濃度で含む市販の組成物で観察されるものと同等またはそれより良好な治療効果が観察可能である、項

1 5 に記載の方法。

1 7. 局所障害が痔、裂肛、肛門亀裂、痔瘻、肛門膿瘍および肛門掻痒症からなる群から選択される、項 1 5 に記載の方法。

1 8. 局所障害が性器疣贅または肛門疣贅である、項 1 5 に記載の方法。

1 9. 局所障害が疱疹である、項 1 5 に記載の方法。

2 0. 局所障害がアクネまたは酒さである、項 1 5 に記載の方法。

2 1. 処置を必要とする対象の体表面に治療有効濃度の項 1 に記載の組成物を 2 日に 1 回局所適用することを含む、局所障害の処置方法。

2 2. 該組成物の局所適用後一定時間後、1 日数回適用する同一成分を同一濃度で含む市販の組成物で観察されるのと同様またはそれより良好な治療効果が観察可能である、項 2 1 に記載の方法。

2 3. 局所障害が痔、裂肛、肛門亀裂、痔瘻、肛門膿瘍および肛門掻痒症からなる群から選択される、項 2 1 に記載の方法。

2 4. 局所障害が性器疣贅または肛門疣贅である、項 2 1 に記載の方法。

2 5. 局所障害がアクネまたは酒さである、項 2 1 に記載の方法。

2 6. 局所障害が疱疹である、項 2 1 に記載の方法。

2 7. 処置を必要とする対象の体表面に治療有効濃度の項 1 に記載の組成物を週に 2 回局所適用することを含む、局所障害の処置方法。

2 8. 該組成物の局所適用後一定時間後、1 日数回適用する同一成分を同一濃度で含む市販の組成物で観察されるのと同様またはそれより良好な治療効果が観察可能である、項 2 7 に記載の方法。

2 9. 局所障害が痔、裂肛、肛門亀裂、痔瘻、肛門膿瘍および肛門掻痒症からなる群から選択される、項 2 7 に記載の方法。

3 0. 局所障害が性器疣贅または肛門疣贅である、項 2 7 に記載の方法。

3 1. 局所障害が疱疹である、項 2 7 に記載の方法。

3 2. 局所障害がアクネまたは酒さである、項 2 7 に記載の方法。

3 3. 項 1 に記載の組成物および保存および組成物の体表面への適用に適する容器 - アプリケーターデバイスを含む、キット。

3 4. 容器 - アプリケーターデバイスが使い捨てワイプ、シリンジ、ドロPPER、スプレーディスペンサー、圧縮性ボトルまたはチューブ、スパーテル、坐薬挿入チューブ、突出チューブおよび可膨張性メンバーからなる群から選択される、項 3 3 に記載のキット。