

【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 1 年 10 月 24 日 (2019.10.24)

【公表番号】特表 2018-531231 (P2018-531231A)

【公表日】平成 30 年 10 月 25 日 (2018.10.25)

【年通号数】公開・登録公報 2018-041

【出願番号】特願 2018-515121 (P2018-515121)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 47/06 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/454

A 6 1 P 17/06

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/06

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/32

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 9 月 9 日 (2019.9.9)

【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】

連続疎水性担体、5～24重量%の1つまたは複数の揮発性シリコーン油、および複数の薬物ナノ粒子を含む、薬物ナノ粒子の皮膚中への浸透を増強するための組成物であって、

該薬物ナノ粒子の平均粒径（個数基準）が0.1ミクロン～1.5ミクロンであり、該組成物がC₁～C₅脂肪族アルコールを含まず、かつ薬物ナノ粒子がタキサンナノ粒子である、組成物。

【請求項 2】

揮発性シリコーン油がシクロメチコンである、請求項 1 記載の組成物。

【請求項 3】

シクロメチコンがシクロペンタシロキサンである、請求項 2 記載の組成物。

【請求項 4】

疎水性担体が炭化水素を含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 5】

炭化水素がワセリン、鉱油、もしくはパラフィンワックス；またはそれらの混合物である、請求項 4 記載の組成物。

【請求項 6】

タキサンナノ粒子がパクリタキセルナノ粒子、ドセタキセルナノ粒子、またはカバジタキセルナノ粒子である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 7】

タキサンナノ粒子がパクリタキセルナノ粒子である、請求項 6 記載の組成物。

【請求項 8】

パクリタキセルナノ粒子が少なくとも $18 \text{ m}^2 / \text{g}$ の比表面積 (SSA) を有する、請求項 7 記載の組成物。

【請求項 9】

半固体組成物である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 10】

半固体組成物が軟膏である、請求項 9 記載の組成物。

【請求項 11】

T - E スピンドルを備えヘリパスをオンにしたヘリパススタンド上の Brookfield RV 粘度計により、10 RPM、室温で 45 秒間測定して、前記組成物の粘度が $25,000 \text{ cps} \sim 500,000 \text{ cps}$ である、請求項 9 または 10 記載の組成物。

【請求項 12】

揮発性シリコン油がシクロペンタシロキサンであり；

連続疎水性担体が不揮発性かつ非極性であり、該組成物の 50 重量%より多く、ワセリン、重鉱油、およびパラフィンワックスを含み；

該組成物が無水半固体軟膏である、
請求項 1 記載の組成物。

【請求項 13】

シクロペンタシロキサン以外に追加の皮膚浸透増強剤も追加の揮発性溶媒も含まず；かつ

界面活性剤を含まない、
請求項 12 記載の組成物。

【請求項 14】

薬物ナノ粒子がパクリタキセルナノ粒子であり、パクリタキセルナノ粒子が 0.1 ~ 5 重量%の濃度であり、かつ前記組成物がタンパク質またはアルブミンを含まない、請求項 12 または 13 記載の組成物。

【請求項 15】

タキサンナノ粒子が 0.1 ~ 5 重量%の濃度である、請求項 1 記載の組成物。

【請求項 16】

連続疎水性担体、5 ~ 24 重量%の 1 つまたは複数の揮発性シリコン油、および複数の薬物ナノ粒子を含む疎水性組成物であって、

該薬物ナノ粒子の平均粒径 (個数基準) が 0.1 ミクロン ~ 1.5 ミクロンであり、

該組成物が $C_1 \sim C_5$ 脂肪族アルコールを含まず、かつ

薬物ナノ粒子がタキサンナノ粒子である、
疎水性組成物。

【請求項 17】

揮発性シリコン油がシクロメチコンである、請求項 16 記載の組成物。

【請求項 18】

シクロメチコンがシクロペンタシロキサンである、請求項 17 記載の組成物。

【請求項 19】

疎水性担体が炭化水素を含む、請求項 16 ~ 18 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 20】

炭化水素がワセリン、鉱油、もしくはパラフィンワックス；またはそれらの混合物である、請求項 19 記載の組成物。

【請求項 21】

タキサンナノ粒子がパクリタキセルナノ粒子、ドセタキセルナノ粒子、またはカバジタキセルナノ粒子である、請求項 16 ~ 20 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 22】

タキサンナノ粒子がパクリタキセルナノ粒子である、請求項 21 記載の組成物。

【請求項 23】

パクリタキセルナノ粒子が少なくとも $18 \text{ m}^2 / \text{g}$ の比表面積 (SSA) を有する、請求項 22 記載の組成物。

【請求項 24】

半固体組成物である、請求項 16 ~ 23 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 25】

半固体組成物が軟膏である、請求項 24 記載の組成物。

【請求項 26】

T - E スピンドルを備えヘリパスをオンにしたヘリパススタンド上の Brookfield RV 粘度計により、10 RPM、室温で 45 秒間測定して、前記組成物の粘度が 25,000 cps ~ 500,000 cps である、請求項 24 または 25 記載の組成物。

【請求項 27】

揮発性シリコン油がシクロペンタシロキサンであり；

連続疎水性担体が不揮発性かつ非極性であり、該組成物の 50 重量%より多く、ワセリン、重鉱油、およびパラフィンワックスを含み；

該組成物が無水半固体軟膏である、
請求項 16 記載の組成物。

【請求項 28】

シクロペンタシロキサン以外に追加の皮膚浸透増強剤も追加の揮発性溶媒も含まず；かつ

界面活性剤を含まない、

請求項 27 記載の組成物。

【請求項 29】

薬物ナノ粒子がパクリタキセルナノ粒子であり、パクリタキセルナノ粒子が 0.1 ~ 5 重量%の濃度であり、かつ前記組成物がタンパク質またはアルブミンを含まない、請求項 27 または 28 記載の組成物。

【請求項 30】

タキサンナノ粒子が 0.1 ~ 5 重量%の濃度である、請求項 16 記載の組成物。

【請求項 31】

タキサンナノ粒子が結晶性タキサンナノ粒子である、請求項 1 記載の組成物。

【請求項 32】

前記組成物の 50 重量%より多い連続疎水性担体、および前記組成物の 0.1 ~ 5 重量%より多い結晶性タキサンナノ粒子を含む、請求項 31 記載の組成物。

【請求項 33】

半固体軟膏であり、抗生物質および噴射剤を含まない、請求項 32 記載の組成物。

【請求項 34】

タキサンナノ粒子が結晶性タキサンナノ粒子である、請求項 16 記載の組成物。

【請求項 35】

前記組成物の 50 重量%より多い連続疎水性担体、および前記組成物の 0.1 ~ 5 重量%より多い結晶性タキサンナノ粒子を含む、請求項 34 記載の組成物。

【請求項 3 6】

半固体軟膏であり、抗生物質および噴射剤を含まない、請求項 3 5 記載の組成物。