

【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29年2月9日(2017.2.9)

【公表番号】特表2016-504367(P2016-504367A)

【公表日】平成28年2月12日(2016.2.12)

【年通号数】公開・登録公報2016-010

【出願番号】特願2015-550783(P2015-550783)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成28年12月22日(2016.12.22)

【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】

局所的適用のための柔軟な有限システムの形態にある、NSAIDを経皮送達するための組成物であって、(i) 治療的に有効な量のNSAID、(ii) シリコンポリマー、及び(iii) アクリル系ポリマー又はアクリル系ブロックコポリマーを含有するポリマーマトリックスを含むことを特徴とする、前記組成物。

【請求項2】

前記ポリマーマトリックスが、スチレン-イソブレン-スチレンブロックコポリマーを更に含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記ポリマーマトリックスが、浸透促進剤を更に含む、請求項1又は2に記載の組成物。

【請求項4】

前記NSAIDがフルルビプロフェンを含む、請求項1～3の何れか1項に記載の組成物。

【請求項5】

前記ポリマーマトリックスが、非官能性アクリル系ポリマーを含む、請求項1～4の何れか1項に記載の組成物。

【請求項6】

前記ポリマーマトリックスが、アクリル系ブロックコポリマーを含む、請求項1～5の何れか1項に記載の組成物。

【請求項7】

前記ポリマーマトリックスが、約3質量%～5質量%のフルルビプロフェンを含む、請求項1～6の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 8】**

前記ポリマーマトリックスが、約4～5質量%のアクリル系ポリマーを含む、請求項1～7の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 9】**

前記ポリマーマトリックスが、約5質量%のアクリル系ブロックコポリマーを含む、請求項1～8の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 10】**

前記ポリマーマトリックスが、約1質量%までのスチレン-イソブレン-スチレンブロックコポリマーを含む、請求項1～9の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 11】**

前記ポリマーマトリックスが、少なくとも約80質量%のシリコンポリマーを含む、請求項1～10の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 12】**

前記システムが、少なくとも8時間の期間に渡り前記NSAIDの送達を達成する、請求項1～11の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 13】**

前記システムが、少なくとも12時間の期間に渡り前記NSAIDの送達を達成する、請求項1～12の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 14】**

前記システムが、少なくとも24時間の期間に渡り前記NSAIDの送達を達成する、請求項1～13の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 15】**

裏地層を更に含む、請求項1～14の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 16】**

柔軟な閉塞性裏地層を更に含む、請求項1～15の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 17】**

前記柔軟な閉塞性裏地層が伸縮性である、請求項16に記載の組成物。

**【請求項 18】**

前記柔軟な閉塞性裏地層が、閉塞性塗膜で被覆された基布材料で構成されている、請求項16～17の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 19】**

前記閉塞性塗膜が、ポリイソブチレン及び/又はスチレン-イソブレン-スチレン(SIS)ブロックコポリマーを含む、請求項18に記載の組成物。

**【請求項 20】**

NSAIDを経皮送達するための方法であって、請求項1～19の何れか1項に記載の組成物を、該NSAIDを必要とする非ヒト対象の皮膚又は粘膜に局所的に適用する工程を含む、前記方法。

**【請求項 21】**

NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に、NSAIDを経皮送達する方法において使用するための請求項1～19の何れか1項に記載の組成物。

**【請求項 22】**

NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に、NSAIDを経皮送達するための医薬の製造におけるNSAIDの使用であって、該医薬が、局所的適用のための柔軟な有限システムの形態にあり、(i) 治療的に有効な量の該NSAID、(ii) シリコンポリマー、及び(iii) アクリル系ポリマー又はアクリル系ブロックコポリマーを含有するポリマーマトリックスを含むことを特徴とする、前記使用。

**【請求項 23】**

活性薬剤を経皮送達するための柔軟な有限システムであって、(i) 該活性薬剤及び1種以上のポリマーを含有するポリマーマトリックス、並びに(ii) 閉塞性塗膜で被覆された基布材料で構成される柔軟な閉塞性裏地層を含むことを特徴とする、前記柔軟な有限シス

テム。

【請求項 2 4】

前記柔軟な閉塞性裏地層が伸縮性である、請求項23に記載の柔軟な有限システム。

【請求項 2 5】

前記柔軟な有限システムが伸縮性である、請求項24に記載の柔軟な有限システム。

【請求項 2 6】

NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に、NSAIDを経皮送達する方法において使用するための、請求項23～25の何れか1項に記載の柔軟な有限システム。

【請求項 2 7】

NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に、NSAIDを経皮送達する医薬の製造におけるNSAIDの使用であって、該医薬が、(i) 該活性薬剤及び1種以上のポリマーを含有するポリマーマトリックス、並びに(ii) 閉塞性塗膜で被覆された基布材料で構成される柔軟な閉塞性裏地層を含む柔軟な有限システムの形態にあることを特徴とする、前記使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 4 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 4 7】

実施例6

上述の製剤を用いて製造したシステムを、痛みに関する動物モデル、即ちラットにおける酵母誘発性痛覚過敏症モデルにおいて使用した。該システム(1cm<sup>2</sup>または2cm<sup>2</sup>)を、酵母注射前3時間に渡り該動物の右後肢に局部的に適用した。痛覚閾値は、該酵母注射の3時間後に測定した。結果を図6に示す。各値は、動物10匹に関する平均値±S.E.を表す。フルルビプロフェン市販パッチ[ヤクバンテープ(Yakuban Tape)]およびケトプロフェン(Ketprofen)市販パッチ[モーステープ(Mohrus Tape)]も、対照として評価した。ここに記載された製剤は、該市販品に等価な、強力な鎮痛効果を示した。

本発明の好ましい態様は、下記の通りである。

〔1〕局所的適用のための柔軟な有限システムの形態にある、NSAIDを経皮送達するための組成物であって、(i) 治療的に有効な量のNSAID、(ii) シリコンポリマー、及び(iii) アクリル系ポリマー又はアクリル系ブロックコポリマーを含有するポリマーマトリックスを含むことを特徴とする、前記組成物。

〔2〕前記ポリマーマトリックスが、スチレン-イソブレン-スチレンブロックコポリマーを更に含む、前記〔1〕に記載の組成物。

〔3〕前記ポリマーマトリックスが、浸透促進剤を更に含む、前記〔1〕又は〔2〕に記載の組成物。

〔4〕前記NSAIDがフルルビプロフェンを含む、前記〔1〕～〔3〕の何れか1項に記載の組成物。

〔5〕前記ポリマーマトリックスが、非官能性アクリル系ポリマーを含む、前記〔1〕～〔4〕の何れか1項に記載の組成物。

〔6〕前記ポリマーマトリックスが、アクリル系ブロックコポリマーを含む、前記〔1〕～〔5〕の何れか1項に記載の組成物。

〔7〕前記ポリマーマトリックスが、約3質量%～5質量%のフルルビプロフェンを含む、前記〔1〕～〔6〕の何れか1項に記載の組成物。

〔8〕前記ポリマーマトリックスが、約4～5質量%のアクリル系ポリマーを含む、前記〔1〕～〔7〕の何れか1項に記載の組成物。

〔9〕前記ポリマーマトリックスが、約5質量%のアクリル系ブロックコポリマーを含む、前記〔1〕～〔8〕の何れか1項に記載の組成物。

〔10〕前記ポリマーマトリックスが、約1質量%までのスチレン-イソブレン-スチレンブロックコポリマーを含む、前記〔1〕～〔9〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 1 1 〕 前記ポリマーマトリックスが、少なくとも約80質量%のシリコンポリマーを含む、前記〔1〕～〔10〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 1 2 〕 前記システムが、少なくとも8時間の期間に渡り前記NSAIDの送達を達成する、前記〔1〕～〔11〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 1 3 〕 前記システムが、少なくとも12時間の期間に渡り前記NSAIDの送達を達成する、前記〔1〕～〔12〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 1 4 〕 前記システムが、少なくとも24時間の期間に渡り前記NSAIDの送達を達成する、前記〔1〕～〔13〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 1 5 〕 裏地層を更に含む、前記〔1〕～〔14〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 1 6 〕 柔軟な閉塞性裏地層を更に含む、前記〔1〕～〔15〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 1 7 〕 前記柔軟な閉塞性裏地層が伸縮性である、前記〔16〕に記載の組成物。

〔 1 8 〕 前記柔軟な閉塞性裏地層が、閉塞性塗膜で被覆された基布材料で構成されている、前記〔16〕～〔17〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 1 9 〕 前記閉塞性塗膜が、ポリイソブチレン及び/又はスチレン-イソブレン-スチレン(SIS)ブロックコポリマーを含む、前記〔18〕に記載の組成物。

〔 2 0 〕 NSAIDを経皮送達するための方法であって、前記〔1〕～〔19〕の何れか1項に記載の組成物を、該NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に局所的に適用する工程を含む、前記方法。

〔 2 1 〕 NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に、NSAIDを経皮送達する方法において使用するための前記〔1〕～〔20〕の何れか1項に記載の組成物。

〔 2 2 〕 NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に、NSAIDを経皮送達するための医薬の製造におけるNSAIDの使用であって、該医薬が、局所的適用のための柔軟な有限システムの形態にあり、(i) 治療的に有効な量の該NSAID、(ii) シリコンポリマー、及び(iii) アクリル系ポリマー又はアクリル系ブロックコポリマーを含有するポリマーマトリックスを含むことを特徴とする、前記使用。

〔 2 3 〕 活性薬剤を経皮送達するための柔軟な有限システムであって、(i) 該活性薬剤及び1種以上のポリマーを含有するポリマーマトリックス、並びに(ii) 閉塞性塗膜で被覆された基布材料で構成される柔軟な閉塞性裏地層を含むことを特徴とする、前記柔軟な有限システム。

〔 2 4 〕 前記柔軟な閉塞性裏地層が伸縮性である、前記〔23〕に記載の柔軟な有限システム。

〔 2 5 〕 前記柔軟な有限システムが伸縮性である、前記〔24〕に記載の柔軟な有限システム。

〔 2 6 〕 NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に、NSAIDを経皮送達する方法において使用するための、前記〔23〕～〔25〕の何れか1項に記載の柔軟な有限システム。

〔 2 7 〕 NSAIDを必要とする対象の皮膚又は粘膜に、NSAIDを経皮送達する医薬の製造におけるNSAIDの使用であって、該医薬が、(i) 該活性薬剤及び1種以上のポリマーを含有するポリマーマトリックス、並びに(ii) 閉塞性塗膜で被覆された基布材料で構成される柔軟な閉塞性裏地層を含む柔軟な有限システムの形態にあることを特徴とする、前記使用。