

【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6月29日(2017.6.29)

【公表番号】特表2017-508802(P2017-508802A)

【公表日】平成29年3月30日(2017.3.30)

【年通号数】公開・登録公報2017-013

【出願番号】特願2016-575611(P2016-575611)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/573	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/107	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/573
A 6 1 K	47/10
A 6 1 K	9/107
A 6 1 P	17/06
A 6 1 P	17/04

【手続補正書】

【提出日】平成29年5月17日(2017.5.17)

【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】

a ) コルチコステロイド； b ) 脂肪族アルコール； c ) 少なくとも1つの医薬的および  
/または皮膚科学的に許容な賦形剤；ならびに d ) 水を含む水性局所用組成物であり、e )  
ここで前記組成物がプロピレングリコールを含まないか；または前記コルチコステロイ  
ドがベタメタゾン化合物であり、前記脂肪族アルコールがオレイルアルコールであり、i )  
前記組成物が皮膚デポー組成物であるか；もしくは i i ) 前記組成物におけるエノール  
アルデヒド不純物が、25%で少なくとも6ヶ月期間約1%よりも低いか；もしくは i i i )  
前記組成物が、皮膚層に適用量の約0.1%～約20%のベタメタゾン類の保持を提  
供する、水性局所用スプレー組成物。

【請求項2】

前記組成物が、どんなフィルム層も形成しない、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記脂肪族アルコールが、リノレイルアルコール、リノレニルアルコール、ベヘニルアルコール、セトステアリルアルコール、2-ヘプチル-1-ウンデカノール、1,17-ヘプタデカンジオール、オレイルアルコール、エライジルアルコール、カプリルアルコール、ラウリルアルコール、ステアリルアルコールおよびそれらの混合物からなる群から任意に選択され；ここで前記脂肪族アルコールが、全組成物の約0.01重量%～約1.5重量%の量で任意に存在する、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記コルチコステロイドが、ベタメタゾン化合物であり、ベタメタゾンベンゾエート、  
ベタメタゾンジプロピオネート、ベタメタゾンナトリウムホスフェート、ベタメタゾンバ

レレートおよびそれらの組み合わせからなる群から任意に選択され、前記ベタメタゾン化合物が、製品の約 0.025 重量% ~ 約 0.1 重量% に相当する量で任意に存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記医薬的および / または皮膚科学的に許容な賦形剤が:  
カチオン性界面活性剤、アニオン性界面活性剤、双極性イオン性界面活性剤および両性界面活性剤ならびにそれらの組み合わせからなる群から選択される乳化剤;  
ポリオキシ 20 セトステアリルエーテルを含む乳化剤; または  
カルボマー、ポリエチレングリコール、アクリレートポリマー、メタクリレートポリマー、ポリビニルピロリドン、ブチルメタクリレートおよびメチルメタクリレートに基づくコポリマー、ビニルアセテート、ポリビニルアセテート、セルロース、ガム、アルギメント、セルロースアセテートフタレート、セルロースアセテートブチレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレートおよびそれらの組み合わせからなる群から選択されるポリマー

である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

1 以上の抗酸化剤、防腐剤、湿潤剤または可塑剤またはセトステアリルアルコールをさらに含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記組成物が、患者の皮膚に対して実質的に非刺激性であり; ここで前記組成物が、40 で少なくとも約 6 ヶ月の期間または 25 で少なくとも約 24 ヶ月の期間安定であり、ここで前記組成物が非発泡性で、かつ高圧ガスを含まない、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記ベタメタゾン化合物が、ベタメタゾンジプロピオネートである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記組成物におけるエノールアルデヒド不純物が、25 で少なくとも 12 ヶ月期間約 1 % よりも低く; 前記組成物におけるエノールアルデヒド不純物が、25 で少なくとも 18 ヶ月期間約 1 % よりも低く; 前記組成物におけるエノールアルデヒド不純物が、25 で少なくとも 24 ヶ月期間約 1 % よりも低く; または 2 ~ 8 で貯蔵した場合に、少なくとも約 12 ヶ月の期間前記組成物が、エノールアルデヒド不純物を実質的に含まない、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記組成物が、皮膚層において適用量の約 0.1 % ~ 約 10 % のベタメタゾン類の保持を提供するか; または前記組成物が、適用量の約 10 % より低いベタメタゾン類の全身暴露を提供する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記組成物が、皮膚デポー組成物である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記組成物が、水性エマルジョンであるか、または水中油型エマルジョンである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記組成物が、約 35 mm ~ 約 60 mm の第 1 軸、約 35 mm ~ 約 55 mm の第 2 軸を有する、広い角度の完全な円錐状のスプレーパターンのスプレー特性を提供する装置で提供される、アトピー性皮膚炎、脂漏性皮膚炎、湿疹および乾癬の治療に有益な請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記装置が、約 1 ~ 約 1.5 である第 1 および第 2 軸の間の比率を提供するか、または作動当たりの組成物約 65 mg ~ 約 210 mg を送達する、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記スプレーパターンが、投与距離が患者の皮膚から装置まで約20mm～約60mmであり、かつスプレー角度が患者の皮膚に対して約50～70度である場合に得られ、ここで、前記装置は、機械的に作動され得る取り付けられたスプレーポンプクロージャーを備えたボトルである、請求項13に記載の組成物。

**【請求項16】**

前記組成物が、密閉フィルムを形成せずに皮膚にデポーを形成し；ここで前記組成物が水性エマルジョンであるか；または前記組成物が約10～約15,000センチポアズの粘度を有する、請求項13に記載の組成物。

**【請求項17】**

前記組成物が：a)ベタメタゾン化合物；b)オレイルアルコール；c)少なくとも1つの医薬的および／または皮膚科学的に許容な賦形剤；ならびにd)水；を含む水性局所用組成物である、請求項13に記載の組成物。

**【請求項18】**

a)油性相を得るために乳化剤および水非混和性物質を含む混合物を加熱し；  
b)コルチコステロイドを浸透エンハンサーと混ぜ；  
c)b)の材料をa)の混合物と混ぜ；  
d)水相を形成するためにポリマーを水に溶解させ；  
e)エマルジョンを形成するためにc)の油性相をd)の水性相と混ぜる；  
工程を含む、請求項1に記載の組成物の製造方法。

**【請求項19】**

前記コルチコステロイドが任意にベタメタゾン化合物であり、前記ポリマーが任意にヒドロキシエチルセルロースであり、そして前記浸透エンハンサーが任意にオレイルアルコールである、請求項18に記載の製造方法。

**【請求項20】**

工程a)の前記加熱が任意に70±2に至るまでであり；前記工程e)が2400rpmで10分間のホモジナイズを任意に含む、請求項18に記載の製造方法。