

【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3区分

【発行日】令和1年5月9日(2019.5.9)

【公開番号】特開2018-59086(P2018-59086A)

【公開日】平成30年4月12日(2018.4.12)

【年通号数】公開・登録公報2018-014

【出願番号】特願2017-186885(P2017-186885)

【国際特許分類】

C 0 8 J 3/07 (2006.01)

C 0 8 L 1/00 (2006.01)

C 0 8 L 33/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 31/195 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

【 F I 】

C 0 8 J 3/07 C E P

C 0 8 L 1/00

C 0 8 L 33/02

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 31/195

A 6 1 K 9/50

【手続補正書】

【提出日】平成31年3月22日(2019.3.22)

【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】

以下の特性を有する粒子を含む、有効成分の生体組織透過剤：

(a) (i - 1) 2 種以上のセルロース誘導体の混合物、または (i - 2) セルロース誘導体およびセルロース誘導体以外のポリマーの混合物、ならびに (i i) 有効成分を含む

；

(b) 有効成分が粒子内部に含まれる；ならびに

(c) 体積分布平均粒子径が $1 \sim 900 \text{ nm}$ であり、

前記混合物は、親水性ポリマーおよび疎水性ポリマーの混合物であり、

前記粒子は、粒子膜上の水の接触角が $20 \sim 70$ 度であり、

前記有効成分が、分子量 1500 以下の低分子化合物である。

【請求項2】

以下、(i) および (i i) からなる群より選ばれる1以上の性質を有する、請求項1記載の生体組織透過剤：

(i) ポリスチレン基板上の水の接触角に対する、粒子膜上の水の接触角の比率が、 $0.2 \sim 0.9$ の範囲内である；

(i i) 電気泳動による移動度の絶対値が $2 \mu \text{ m cm} / \text{Vs}$ 以上である。

【請求項3】

前記粒子が界面活性剤を実質的に含まない、請求項 1 または 2 記載の生体組織透過剤。

【請求項 4】

セルロース誘導体が、 $R - \text{または} R - C(=O) -$ (式中、 R は、置換されていてもよい炭化水素基を示す。) の置換基を有するセルロース誘導体である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項記載の生体組織透過剤。

【請求項 5】

前記セルロース誘導体が、ヒドロキシプロピルセルロース、エチルセルロース、ヒプロメロースまたはそのエステル誘導体である、請求項 4 記載の生体組織透過剤。

【請求項 6】

セルロース誘導体以外のポリマーが、置換されていてもよい 2 価の炭化水素基をモノマー単位として含むポリマーである、請求項 5 記載の生体組織透過剤。

【請求項 7】

置換されていてもよい 2 価の炭化水素基が、置換されていてもよいアルキレンである、請求項 6 記載の生体組織透過剤。

【請求項 8】

置換されていてもよいアルキレンが、置換されていてもよいエチレンである、請求項 7 記載の生体組織透過剤。

【請求項 9】

セルロース誘導体以外のポリマーが、メタクリル酸コポリマーである、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項記載の生体組織透過剤。

【請求項 10】

前記混合物中の (i - 1) 2 種以上のセルロース誘導体、または (i - 2) セルロース誘導体およびセルロース誘導体以外のポリマーが接触している、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項記載の生体組織透過剤。

【請求項 11】

粒子の重量に対する有効成分量が 0.01 ~ 80% (wt) である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項記載の生体組織透過剤。

【請求項 12】

粒子の重量に対する有効成分量が 0.1 ~ 15% (wt) である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項記載の生体組織透過剤。

【請求項 13】

粒子が非複合粒子である、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項記載の生体組織透過剤。

【請求項 14】

生体組織が皮膚である、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項記載の生体組織透過剤。

【請求項 15】

生体組織が角層である、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項記載の生体組織透過剤。

【請求項 16】

同種のポリマー粒子のみを含む、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項記載の生体組織透過剤

。

【請求項 17】

以下の特性を有する、粒子：

(a) (i - 1) 2 種以上のセルロース誘導体の混合物、または (i - 2) セルロース誘導体およびセルロース誘導体以外のポリマーの混合物、ならびに (i i) 有効成分を含む；

(b) 有効成分が粒子内部に含まれる；ならびに

(c) 体積分布平均粒子径が 1 ~ 900 nm であり、

ここで、(i - 1) 2 種以上のセルロース誘導体の混合物が、(- 1) ヒドロキシアルキルセルロース、カルボキシアルキルセルロース、およびそれらのエステル誘導体からなる群より選ばれるセルロース誘導体、ならびに(- 1) アルキルセルロース、ヒドロキシアルキルアルキルセルロース、疎水化セルロース、およびそれらのエステル誘導体が

らなる群より選ばれるセルロース誘導体の混合物であるか、あるいは

(i - 2)セルロース誘導体およびセルロース誘導体以外のポリマーの混合物が、(- 2)ヒドロキシアルキルセルロース、カルボキシアルキルセルロース、およびそれらのエステル誘導体からなる群より選ばれるセルロース誘導体、ならびに(- 2)ビニル系ポリマー、プロピレン系ポリマー、およびブチレン系ポリマー、ならびにそれらのコポリマーからなる群より選ばれる、セルロース誘導体以外のポリマーの混合物であり、

前記粒子は、粒子膜上の水の接触角が20～70度であり、
前記有効成分が、分子量1500以下の低分子化合物である。

【請求項18】

ヒドロキシアルキルセルロース、カルボキシアルキルセルロース、およびアルキルセルロースにおけるアルキルは、炭素原子数1～4のアルキルであり、

ヒドロキシアルキルアルキルセルロースにおける2つのアルキルは、同一であっても異なってもよく、炭素原子数1～4のアルキルである、請求項17記載の粒子。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0082

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0082】

好ましくは、親水性ポリマーは、有機溶媒に移行し易い親水性ポリマーであってもよい。有機溶媒に移行し易い親水性ポリマーとしては、例えば、ヒドロキシアルキル、カルボキシアルキル、またはカチオン性基で置換されたサッカリドをモノマー単位として含むポリマーが挙げられる。ヒドロキシアルキルおよびカルボキシアルキルにおけるアルキル、およびサッカリドをモノマー単位として含むポリマーはそれぞれ、上述したものと同様であり、好ましい範囲も同様である。有機溶媒に移行し易い親水性ポリマーの具体例としては、それが有する具体的な置換基等の種類にもよるが、ヒドロキシアルキルセルロース、カルボキシアルキルセルロース、カチオン化セルロース、およびそれらのエステル誘導体、ならびにそれらの塩が挙げられる。