

【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20年1月10日(2008.1.10)

【公開番号】特開2007-302690(P2007-302690A)

【公開日】平成19年11月22日(2007.11.22)

【年通号数】公開・登録公報2007-045

【出願番号】特願2007-186380(P2007-186380)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/5575	(2006.01)
A 6 1 K	47/44	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/18	
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	43/00	1 1 2
A 6 1 K	47/36	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/14	
A 6 1 K	31/5575	
A 6 1 K	47/44	
A 6 1 K	47/26	
A 6 1 K	47/32	

【手続補正書】

【提出日】平成19年11月16日(2007.11.16)

【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】

勃起機能障害の処置を必要とする患者の舟状窩に使用するための医薬組成物の製造における、

プロスタグラニジンE₁；

アルキル-2-(N,N-二置換アミノ)-アルカノエート、(N,N-二置換)-アルカノールアルカノエート、医薬的に許容されるその塩およびそれらの混合物からなる群から選択される皮膚浸透増強剤；

多糖ガム；

脂肪族C₁-C₈アルコール、脂肪族C₈-C₃₀エステル、およびその混合物からなる群から選択される親油性化合物；

水；ならびに

組成物の pH を 3 ~ 6 . 5 にする酸性緩衝液
を含む組成物の使用。

【請求項 2】

医薬組成物が、半固体組成物であり、適用した組成物の量の少なくとも 50 % が、舟状窩に保持される、請求項 1 の使用。

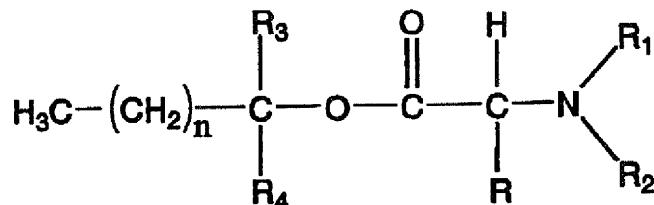
【請求項 3】

医薬組成物が、半固体組成物であり、適用した組成物の量の少なくとも 80 % が、舟状窩に保持される、請求項 1 の使用。

【請求項 4】

前記皮膚浸透増強剤が、式：

【化 1】



[式中、n は、4 ~ 18 までの範囲の数値を有する整数であり；R は、水素、C₁ ~ C₇ アルキル、ベンジルおよびフェニルからなる群から選択され；R₁ および R₂ は、水素および C₁ ~ C₇ アルキルからなる群から選択され；そして、R₃ および R₄ は、水素、メチルおよびエチルからなる群から選択される] により示される、アルキル-2-(N,N-二置換アミノ)-アルカノエートである、請求項 1 記載の使用。

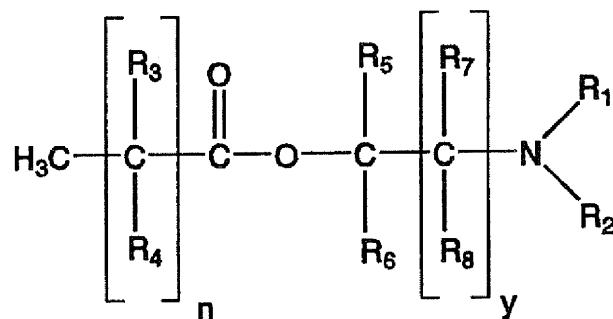
【請求項 5】

前記皮膚浸透増強剤が、C₄ ~ C₁₈ アルキル(N,N-二置換アミノ)-アセテート、(N,N-ジメチルアミノ)-酢酸ドデシルおよび 2-(N,N-ジメチルアミノ)-プロピオン酸ドデシルからなる群から選択される、請求項 1 記載の使用。

【請求項 6】

前記皮膚浸透増強剤が、式：

【化 2】



[式中、n は、5 ~ 18 までの範囲の数値を有する整数であり；y は、0 ~ 5 までの範囲の数値を有する整数であり；そして、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、および R₇ は、水素、C₁ ~ C₈ アルキルおよび C₁ ~ C₈ アリールからなる群から選択され；そして、R₈ は、水素、ヒドロキシル、C₁ ~ C₈ アルキル、および C₁ ~ C₈ アリールからなる群から選択される] により示される、(N,N-二置換アミノ)-アルカノールアルカノエートである、請求項 1 記載の使用。

【請求項 7】

前記皮膚浸透増強剤が、1-(N,N-ジメチルアミノ)-2-プロパノールドデカノエート、1-(N,N-ジメチルアミノ)-2-プロパノールミリストート、および 1-

(N,N-ジメチルアミノ)-2-プロパノールオレエートからなる群から選択される、請求項1記載の使用。

【請求項8】

前記多糖ガムが、ガラクトマンナンガムおよび修飾ガラクトマンナンガムからなる群から選択される、請求項1記載の使用。

【請求項9】

前記ガラクトマンナンガムが、イナゴマメガムまたはグアールガムである、請求項8に記載の使用。

【請求項10】

前記修飾ガラクトマンナンガムが修飾グアールガムである、請求項8記載の使用。

【請求項11】

前記親油性化合物が、エタノール、脂肪族ポリオール、ミリスチン酸イソプロピル、ラウリン酸エチル、エタノールとミリスチン酸イソプロピルとの混合物、またはエタノールとラウリン酸エチルとの混合物である、請求項1記載の使用。

【請求項12】

前記親油性化合物が、少なくとも1つの脂肪族C₈ - C₃₀エステル、またはモノグリセリド、ジグリセリド、トリグリセリドおよびその混合物からなる群から選択される少なくとも1つのグリセリルエステルを含む、請求項1記載の使用。

【請求項13】

前記親油性化合物が、モノオレイン酸グリセリル、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリン、およびその混合物からなる群から選択される少なくとも1つのグリセリルエステルを含む、請求項12に記載の使用。

【請求項14】

前記皮膚浸透増強剤が2-(N,N-ジメチルアミノ)-プロピオン酸ドデシルであり、前記多糖ガムがイナゴマメガムであり、前記親油性化合物がエタノールとラウリン酸エチルとの混合物である、請求項1記載の使用。

【請求項15】

組成物が、組成物の全重量に対して、0.5~5重量%のイナゴマメガム、0.5~2.5重量%の2-(N,N-ジメチルアミノ)-プロピオン酸ドデシル、0.5~8.0重量%のエタノール、および0.5~8.0重量%のミリスチン酸イソプロピルを含む、請求項1記載の使用。

【請求項16】

組成物が、組成物の全重量に対して、0.5~5重量%のイナゴマメガム、0.5~5重量%の2-(N,N-ジメチルアミノ)-プロピオン酸ドデシル、0.5~2.5重量%のエタノール、および0.5~2.5重量%のラウリン酸エチルを含む、請求項1記載の使用。

【請求項17】

組成物がさらに、スクロースエステル、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、長鎖アルコール、およびグリセリルエステルからなる群から選択される乳化剤を含む、請求項1記載の使用。

【請求項18】

前記乳化剤がステアリン酸スクロースである、請求項17に記載の使用。

【請求項19】

前記乳化剤が、モノオレイン酸グリセリル、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリン、およびそれらの混合物からなる群から選択される少なくとも1つのグリセリルエステルを含む、請求項17に記載の使用。

【請求項20】

組成物がさらに、芳香剤、組成物の全重量に対して5重量%までのミルテノール、保存剤、または局所麻酔剤を含む、請求項1記載の使用。

【請求項21】

勃起機能障害の処置を必要とする患者の処置のための舟状窩内投与用の医薬の製造における、

修飾多糖ガム；

PGE₁、医薬的に許容されるその塩、そのC₁ - C₄アルキルエステル、およびそれらの混合物からなる群から選択されるプロスタグラニン；

組成物の全重量に対して0.5～10重量%のDDAIPまたはその塩；

組成物の全重量に対して0.5～10重量%の、エタノール、プロパノール、イソプロパノールおよびそれらの混合物からなる群から選択される低級アルコール；

組成物の全重量に対して0.5～10重量%の、ラウリン酸エチル、ミリスチン酸イソプロピル、ラウリン酸イソプロピルおよびそれらの混合物からなる群から選択されるエステル；ならびに

酸性緩衝液、

を含む、プロスタグラニンE₁含有組成物の使用。

【請求項22】

組成物がさらに、スクロースエステル、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、長鎖アルコール、およびグリセリルエステルからなる群から選択される乳化剤を含む、請求項21に記載の使用。

【請求項23】

前記乳化剤がステアリン酸スクロースである、請求項22に記載の使用。

【請求項24】

前記乳化剤が、モノオレイン酸グリセリル、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリン、およびそれらの混合物からなる群から選択される少なくとも1つのグリセリルエステルを含む、請求項22に記載の使用。

【請求項25】

前記組成物がさらに、芳香剤、組成物の全重量に基づいて5%までのミルテノール、保存剤、または局所麻酔薬を含む、請求項21記載の使用。

【請求項26】

勃起機能障害の治療を必要とする患者において勃起機能障害を治療するための医薬組成物であつて、

プロスタグラニンE₁；

アルキル-2-(N,N-二置換アミノ)-アルカノエート、(N,N-二置換)-アルカノールアルカノエート、医薬的に許容されるその塩およびそれらの混合物からなる群から選択される皮膚浸透増強剤；

多糖ガム；

脂肪族C₁-C₈アルコール、脂肪族C₈-C₃₀エステル、およびその混合物からなる群から選択される親油性化合物；

水；ならびに

組成物のpHを3～6.5にする酸性緩衝液

を含んで成り、

患者の舟状窩に適用される医薬組成物。

【請求項27】

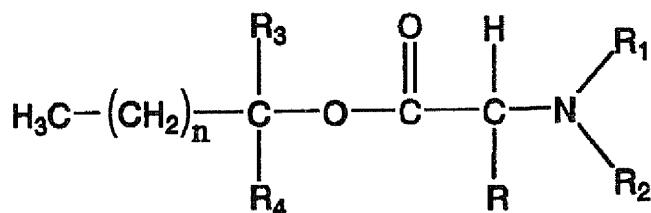
医薬組成物が、半固体組成物であり、適用した組成物の量の少なくとも50%が、舟状窓に保持される、請求項26の医薬組成物。

【請求項28】

医薬組成物が、半固体組成物であり、適用した組成物の量の少なくとも80%が、舟状窓に保持される、請求項26の医薬組成物。

【請求項29】

前記皮膚浸透増強剤が、式：



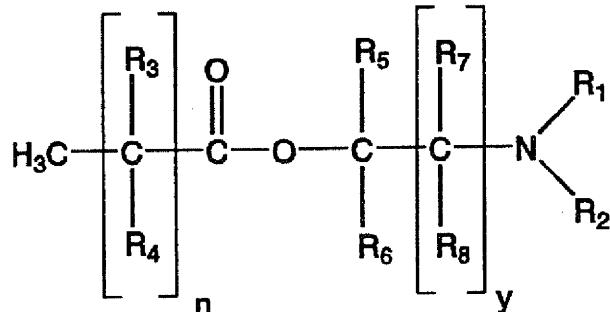
[式中、nは、4～18までの範囲の数値を有する整数であり；Rは、水素、C₁～C₇アルキル、ベンジルおよびフェニルからなる群から選択され；R₁およびR₂は、水素およびC₁～C₇アルキルからなる群から選択され；そして、R₃およびR₄は、水素、メチルおよびエチルからなる群から選択される]により示される、アルキル-2-(N,N-二置換アミノ)-アルカノエートである、請求項26記載の医薬組成物。

【請求項 30】

前記皮膚浸透増強剤が、 $C_4 - C_{18}$ アルキル (N, N-二置換アミノ) - アセテート、(N, N-ジメチルアミノ) - 酢酸ドデシルおよび2-(N, N-ジメチルアミノ) - プロピオン酸ドデシルからなる群から選択される、請求項26記載の医薬組成物。

【請求項 3 1】

前記皮膚浸透増強剤が、式：



[式中、nは、5～18までの範囲の数値を有する整数であり；yは、0～5までの範囲の数値を有する整数であり；そして、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、およびR₇は、水素、C₁～C₈アルキルおよびC₁～C₈アリールからなる群から選択され；そして、R₈は、水素、ヒドロキシル、C₁～C₈アルキル、およびC₁～C₈アリールからなる群から選択される]により示される、(N,N-二置換アミノ)-アルカノールアルカノエートである、請求項26記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

前記皮膚浸透増強剤が、1-(N,N-ジメチルアミノ)-2-プロパノールドデカノエート、1-(N,N-ジメチルアミノ)-2-プロパノールミリストート、および1-(N,N-ジメチルアミノ)-2-プロパノールオレエートからなる群から選択される、請求項26記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

前記多糖ガムが、ガラクトマンナンガムおよび修飾ガラクトマンナンガムからなる群から選択される、請求項26記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

前記ガラクトマンナンガムが、イナゴマメガムまたはグアールガムである、請求項 33 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 5】

前記修飾ガラクトマンナンガムが修飾グアルガムである、請求項33記載の医薬組成物。

【請求項 3 6】

前記親油性化合物が、エタノール、脂肪族ポリオール、ミリスチン酸イソプロピル、ラウリン酸エチル、エタノールとミリスチン酸イソプロピルとの混合物、またはエタノール

とラウリン酸エチルとの混合物である、請求項 2 6 記載の医薬組成物。

【請求項 3 7】

前記親油性化合物が、少なくとも 1 つの脂肪族 C₈ - C₃₀ エステル、またはモノグリセリド、ジグリセリド、トリグリセリドおよびその混合物からなる群から選択される少なくとも 1 つのグリセリルエステルを含む、請求項 2 6 記載の医薬組成物。

【請求項 3 8】

前記親油性化合物が、モノオレイン酸グリセリル、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリン、およびその混合物からなる群から選択される少なくとも 1 つのグリセリルエステルを含む、請求項 3 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 9】

前記皮膚浸透増強剤が 2 - (N, N - ジメチルアミノ) - プロピオン酸ドデシルであり、前記多糖ガムがイナゴマメガムであり、前記親油性化合物がエタノールとラウリン酸エチルとの混合物である、請求項 2 6 記載の医薬組成物。

【請求項 4 0】

組成物が、組成物の全重量に対して、0.5 ~ 5 重量% のイナゴマメガム、0.5 ~ 2.5 重量% の 2 - (N, N - ジメチルアミノ) - プロピオン酸ドデシル、0.5 ~ 8.0 重量% のエタノール、および 0.5 ~ 8.0 重量% のミリスチン酸イソプロピルを含む、請求項 2 6 記載の医薬組成物。

【請求項 4 1】

組成物が、組成物の全重量に対して、0.5 ~ 5 重量% のイナゴマメガム、0.5 ~ 5 重量% の 2 - (N, N - ジメチルアミノ) - プロピオン酸ドデシル、0.5 ~ 2.5 重量% のエタノール、および 0.5 ~ 2.5 重量% のラウリン酸エチルを含む、請求項 2 6 記載の医薬組成物。

【請求項 4 2】

組成物がさらに、スクロースエステル、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、長鎖アルコール、およびグリセリルエステルからなる群から選択される乳化剤を含む、請求項 2 6 記載の医薬組成物。

【請求項 4 3】

前記乳化剤がステアリン酸スクロースである、請求項 4 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 4】

前記乳化剤が、モノオレイン酸グリセリル、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリン、およびそれらの混合物からなる群から選択される少なくとも 1 つのグリセリルエステルを含む、請求項 4 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

組成物がさらに、芳香剤、組成物の全重量に対して 5 重量% までのミルテノール、保存剤、または局所麻酔剤を含む、請求項 2 6 記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

勃起機能障害の治療を必要とする患者において勃起機能障害を治療するための舟状窓投与用プロスタグラニン E₁ 含有医薬組成物であって、

修飾多糖ガム；

PGE₁、医薬的に許容されるその塩、その C₁ - C₄ アルキルエステル、およびそれらの混合物からなる群から選択されるプロスタグラニン；

組成物の全重量に対して 0.5 ~ 1.0 重量% の DDAIP またはその塩；

組成物の全重量に対して 0.5 ~ 1.0 重量% の、エタノール、プロパノール、イソプロパノールおよびそれらの混合物からなる群から選択される低級アルコール；

組成物の全重量に対して 0.5 ~ 1.0 重量% の、ラウリン酸エチル、ミリスチン酸イソプロピル、ラウリン酸イソプロピルおよびそれらの混合物からなる群から選択されるエステル；ならびに

酸性緩衝液
を含んで成り、

患者の舟状窓に適用されるプロスタグラジン E₁ 含有組成物。

【請求項 4 7】

組成物がさらに、スクロースエステル、ポリオキシエチレンソルビタンエステル、長鎖アルコール、およびグリセリルエステルからなる群から選択される乳化剤を含む、請求項 4 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 8】

前記乳化剤がステアリン酸スクロースである、請求項 4 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 9】

前記乳化剤が、モノオレイン酸グリセリル、トリオレイン、トリミリスチン、トリステアリン、およびそれらの混合物からなる群から選択される少なくとも 1 つのグリセリルエステルを含む、請求項 4 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 0】

前記組成物がさらに、芳香剤、組成物の全重量に基づいて 5 %までのミルテノール、保存剤、または局所麻酔薬を含む、請求項 4 6 記載の医薬組成物。