

【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、

プロスタグランジン 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。

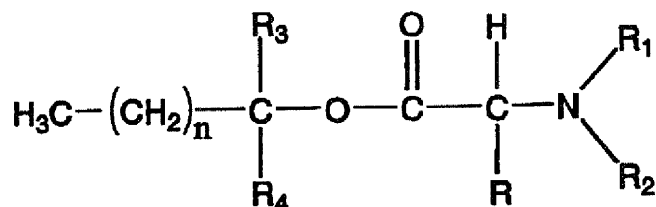
【請求項 3】

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。

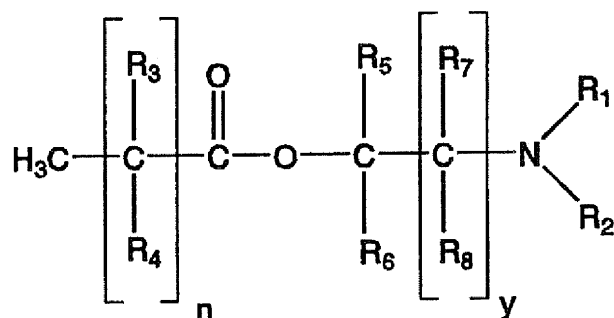
【請求項 5】

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テート、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 $C_8 - C_{30}$ 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 ~ 25 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 ~ 80 重量 % のエタノール、および 0.5 ~ 80 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 ~ 25 重量 % のエタノール、および 0.5 ~ 25 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ンジン；

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、プロスタグランジン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に記載の使用。

【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って、

プロスタグランジン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】

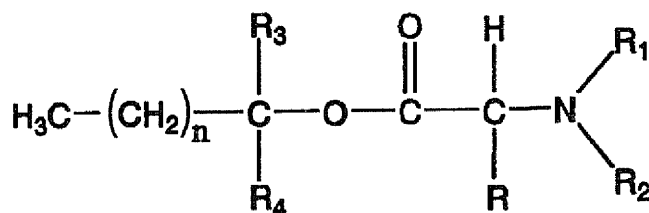
医薬組成物が、半固体組成物であり、適用した組成物の量の少なくとも50%が、舟状窩に保持される、請求項26の医薬組成物。

【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、舟状窩に保持される、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：



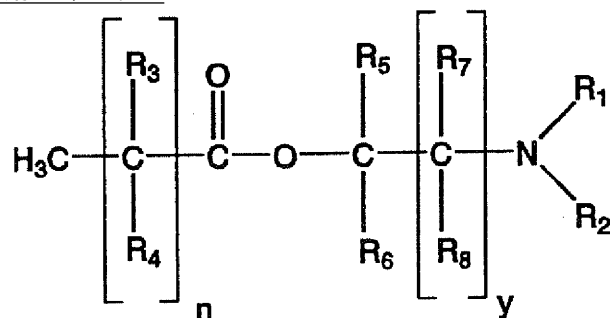
[式中、 n は、4 ～ 18 までの範囲の数値を有する整数であり； R は、水素、 $C_1 - C_7$ アルキル、ベンジルおよびフェニルからなる群から選択され； R_1 および R_2 は、水素および $C_1 - C_7$ アルキルからなる群から選択され；そして、 R_3 および R_4 は、水素、メチルおよびエチルからなる群から選択される] により示される、アルキル - 2 - (N, N - 二置換アミノ) - アルカノエートである、請求項 26 記載の医薬組成物。

【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 31】

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、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、および R_7 は、水素、 $C_1 - C_8$ アルキルおよび $C_1 - C_8$ アリールからなる群から選択され；そして、 R_8 は、水素、ヒドロキシル、 $C_1 - C_8$ アルキル、および $C_1 - C_8$ 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 32】

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テート、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 33】

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 34】

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 35】

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 33 記載の医薬組成物。

【請求項 36】

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 $C_8 - C_{30}$ 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窩投与用プロスタグランジン E_1 含有医薬組成物であって、

修飾多糖ガム；

P G E $_1$ 、医薬的に許容されるその塩、その $C_1 - C_4$ 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ンジン；

組成物の全重量に対して 0 . 5 ~ 1 0 重量 % の D D A I P 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、

患者の舟状窩に適用されるプロスタグランジン E₁ 含有組成物。

【請求項 47】

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 46 に記載の医薬組成物。

【請求項 48】

前記乳化剤がステアリン酸スクロースである、請求項 47 に記載の医薬組成物。

【請求項 49】

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 47 に記載の医薬組成物。

【請求項 50】

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 46 に記載の医薬組成物。