

【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23年12月8日 (2011.12.8)

【公表番号】特表2011-502172(P2011-502172A)

【公表日】平成23年1月20日 (2011.1.20)

【年通号数】公開・登録公報2011-003

【出願番号】特願2010-532376(P2010-532376)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/56 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 P 15/18 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 15/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/56

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 15/18

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 15/16

A 6 1 K 9/12

【手続補正書】

【提出日】平成23年10月21日 (2011.10.21)

【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】

ホルモンおよびステロイドから選択される少なくとも 1 つの薬理作用物質、平均分子量 300 以下のポリエチレングリコール (PEG) を含む浸透促進剤、ならびに全組成物の 70 重量% ~ 95 重量% の範囲の量の C₂ - C₄ アルカノールおよびその混合物から選択される溶媒を含む組成物を含む、経皮送達システム。

【請求項 2】

平均分子量 300 以下の PEG が全組成物の 少なくとも 0.1 重量% の量にて存在する、請求項 1 の経皮送達システム。

【請求項 3】

平均分子量 300 以下のポリエチレングリコールが全組成物の 0.5 重量% ~ 20 重量% の範囲の量にて存在する、前述の請求項のいずれか 1 項の経皮送達システム。

【請求項 4】

組成物が本質的に、

- (i) ホルモンおよびステロイドから選択される少なくとも1つの薬理作用物質；
 - (i i) 平均分子量300以下のポリエチレングリコールからなる浸透促進成分；
 - (i i i) エタノールおよびイソプロパノールの1つ以上からなる揮発性溶媒；ならびに
 - (i v) 任意に噴霧剤、
- からなる、前述の請求項のいずれか1項の経皮送達システム。

【請求項5】

組成物の総含水量が全組成物の10重量%未満である、前述の請求項のいずれか1項の経皮送達システム。

【請求項6】

非閉塞性である、前述の請求項のいずれか1項の経皮送達システム。

【請求項7】

薬理作用物質に対する浸透促進剤の重量比が $\frac{20}{1} : 1 \sim 1 : 1$ の範囲にある、前述の請求項のいずれか1項の経皮送達システム。

【請求項8】

少なくとも1つの薬理作用物質がステロイド系ホルモンからなる群から選択される1つ以上を含む、前述の請求項のいずれか1項の経皮送達システム。

【請求項9】

少なくとも1つの薬理作用物質がエストロゲン、アンドロゲン、グルココルチコイド、アドレノコルチコイド、タンパク質同化または受胎調節活性を提供する1つ以上のステロイドを含む、前述の請求項のいずれか1項の経皮送達システム。

【請求項10】

薬理作用物質がデキサメタゾン、酢酸デキサメタゾン、リン酸デキサメタゾンナトリウム、コルチゾン、酢酸コルチゾン、ヒドロコルチゾン、酢酸ヒドロコルチゾン、シピオン酸ヒドロコルチゾン、リン酸ヒドロコルチゾンナトリウム、コハク酸ヒドロコルチゾンナトリウム、プレドニゾン、プレドニゾロン、酢酸プレドニゾロン、リン酸プレドニゾロンナトリウム、テプト酸プレドニゾロン、ピバル酸プレドニゾロン、トリアムシノロン、トリアムシノロンアセトニド、トリアムシノロンヘキサアセトニド、二酢酸トリアムシノロン、メチルプレドニゾロン、酢酸メチルプレドニゾロン、コハク酸メチルプレドニゾロンナトリウム、フルニソリド、ニプロピオン酸ベクロメタゾン、リン酸ベタメタゾンナトリウム、ベタメタゾン、リン酸ベタメタゾン二ナトリウム、リン酸ベタメタゾンナトリウム、酢酸ベタメタゾン、リン酸ベタメタゾン二ナトリウム、酢酸クロロプレドニゾン、コルチコステロン、デスオキシコルチコステロン、酢酸デスオキシコルチコステロン、ピバル酸デスオキシコルチコステロン、デスオキシメタゾン、エストラジオール、フルドロコルチゾン、酢酸フルドロコルチゾン、酢酸ジクロリゾン、フルオロヒドロコルチゾン、フルオロメトロン、フルプレドニゾロン、パラメタゾン、酢酸パラメタゾン、アンドロステロン、フルオキシメステロン、アルドステロン、メタンドロステノロン、メチルアンドロステジオール、メチルテストステロン、ノルエタンドロロン、テストステロン、エナンチ酸テストステロン、プロピオン酸テストステロン、エキレニン、エキリン、安息香酸エストラジオール、ニプロピオン酸エストラジオール、エストリオール、エストロン、安息香酸エストロン、アセトキシプレグネノロン、酢酸アナゲストン、酢酸クロルマジノン、酢酸フルロゲストン、ヒドロキシメチルプロゲステロン、酢酸ヒドロキシメチルプロゲステロン、ヒドロキシプロゲステロン、酢酸ヒドロキシプロゲステロン、カブロン酸ヒドロキシプロゲステロン、酢酸メレンゲストロール、ノルメチステロン、プレグネノロン、プロゲステロン、エチニルエストラジオール、メストラノール、ジメチステロン、エチステロン、二酢酸エチノジオール、ノルエチンドロン、酢酸ノルエチンドロン、ノルエチステロン、フルオシノロンアセトニド、フルランドレノロン、コハク酸ヒドロコルチゾンナトリウム、コハク酸メチルプレドニゾロンナトリウム、リン酸プレドニゾロンナトリウム、トリアムシノロンアセトニド、ヒドロキシジオンナトリウム、スピロノラクトン、オキシサンドロロン、オキシメトロン、プロメトロン、シピオン酸テストステロン、フェニル酢酸テストステロン、シピオン酸エストラジオール、およびノルエチノドレル、ならびにその塩

およびプロドラッグからなる群から選択される 1 つ以上のステロイドを含む、請求項 9 の経皮送達システム。

【請求項 11】

1 つ以上のエストロゲンおよび 1 つ以上のプロゲステンを含む女性避妊用の、前述の請求項のいずれか 1 項の経皮送達システム。

【請求項 12】

薬物送達システムが重量ベースで 0.1 ~ 10 % のステロイドまたはホルモン、0.1 ~ 12 % の浸透促進剤、および 78 ~ 99.8 % のエタノール、イソプロパノールまたはその混合物を含む、前述の請求項のいずれか 1 項の経皮送達システム。

【請求項 13】

経皮組成物を収容する容器、噴霧ノズル、および該噴霧ノズルを経由して該容器から定量噴霧を送達するためのアクチュエータを含む噴霧装置をさらに含む、請求項 1 の経皮送達システム。

【請求項 14】

ホルモンおよびステロイドから選択される少なくとも 1 つの薬理作用物質の経皮投与用の、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項の経皮送達システム。

【請求項 15】

経皮投与が対象の皮膚表面の部位への適用によって行われる、請求項 14 の経皮送達システム。

【請求項 16】

対象がテストステロン欠乏性の性機能低下男性の男性ホルモン補充、閉経後女性用の女性ホルモン補充療法、性欲が欠如している女性もしくはうつに苦しむ女性用のアンドロゲンを用いたアンドロゲン補充療法、男性避妊または女性避妊を必要としている、請求項 15 の経皮送達システム。

【請求項 17】

対象の皮膚表面の部位への投与用の組成物を含む経皮送達システムの製造方法であって、ホルモンおよびステロイドから選択される少なくとも 1 つの薬理作用物質、平均分子量 300 以下のポリエチレングリコールを含む浸透促進剤、ならびに組成物の 70 重量% ~ 95 重量% の C₂ - C₄ アルカノールおよびその混合物から選択される溶媒を組み合わせることを含む製造方法。