

【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27年3月12日(2015.3.12)

【公表番号】特表2014-510041(P2014-510041A)

【公表日】平成26年4月24日(2014.4.24)

【年通号数】公開・登録公報2014-021

【出願番号】特願2013-551271(P2013-551271)

【国際特許分類】

A 6 1 K	9/107	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/08	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	9/08	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	21/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	13/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/10	(2006.01)
A 6 1 K	39/395	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	9/107
A 6 1 K	47/14
A 6 1 K	47/34
A 6 1 K	45/00
A 6 1 K	37/02
A 6 1 P	17/00
A 6 1 P	17/02

A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 17/08  
A 6 1 P 17/14  
A 6 1 P 31/04  
A 6 1 P 31/10  
A 6 1 P 31/12  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 9/08  
A 6 1 P 37/02  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 27/02  
A 6 1 P 1/06  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 25/02  
A 6 1 P 21/02  
A 6 1 P 25/04  
A 6 1 P 25/06  
A 6 1 P 13/08  
A 6 1 P 11/02  
A 6 1 P 17/04  
A 6 1 P 13/10  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 17/10  
A 6 1 K 39/395

**【手続補正書】**

【提出日】平成27年1月22日(2015.1.22)

**【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】**

ナノ粒子組成物、既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤、および少なくとも1つの賦形剤を含む医薬組成物であって、

前記ナノ粒子組成物が粒子の集団を含み、

前記粒子の大部分が約10～約300ナノメートルの直径を有し、

前記ナノ粒子組成物が少なくとも1つの水性分散媒、少なくとも1つの油、および少なくとも1つの界面活性物質を含み、

前記油が中鎖トリグリセリドであり、

前記界面活性物質がポリソルベートであり、

前記界面活性物質に対する油の比率が約0.5：1～約1：1であり、

前記少なくとも1つの賦形剤が、鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化剤、プロピルパラベン、メチルパラベンまたはそれらの任意の組み合わせである、医薬組成物。

**【請求項2】**

前記中鎖トリグリセリドが6～12個の炭素原子を含む酸であるか、または13～9才

イルである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記ポリソルベートがポリソルベート 80 である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記医薬組成物がパラベンを含まない、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がタンパク質、抗体、タンパク質複合体もしくはそれらの組み合わせであるか、または前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がボツリヌス毒素である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記ボツリヌス毒素が、A 型、A b 型、A f 型、B 型、B f 型、C 1 型、C 2 型、D 型、E 型、F 型、G 型およびそれらの任意の組み合わせを含む群から選択され、必要に応じて、前記ボツリヌス毒素が A 型ボツリヌス毒素である、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記医薬組成物が局所投与用、非経口投与用または経口投与用に製剤化される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

局所投与用に製剤化された前記医薬組成物が、

(i) 皮膚を変質または変化させずに該皮膚に浸透可能である、

(ii) 皮膚透過促進剤または表皮剥脱物質を使用せずに皮膚に浸透可能である、

(iii) 皮膚透過促進剤または表皮剥脱物質を使用せずに皮膚上層に浸透可能である、または

それらの組み合わせであり、

必要に応じて、前記皮膚上層が

(a) 角質層表面である、

(b) 真皮孔を含む、

(c) 真皮腺を含む、または

それらの組み合わせである、

請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記医薬組成物が液体投与形態として製剤化されるか、または滅菌された注入可能な製剤として製剤化される、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記医薬組成物が長期貯蔵の後に安定なままであり、前記長期貯蔵が、少なくとも 1 週間、少なくとも 2 週間、少なくとも 1 カ月、少なくとも 2 カ月、少なくとも 3 カ月、少なくとも 6 カ月、少なくとも 9 カ月、または少なくとも 12 カ月であり、必要に応じて、前記長期貯蔵が 2 ~ 8 で実施される、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物を含むキット。

【請求項 12】

前記組成物が対象に投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記医薬組成物が、

(i)

(a) 皮脂腺に関連する状態または障害、

(b) 汗腺に関連する状態または障害、

(c) 毛包に関連する状態または障害、皮膚の外層、または

それらの任意の組み合わせ、または

(i i) 座瘡、多汗症、望ましくない発汗、臭汗症、体臭、色汗症、過剰皮脂産出障害、脂漏症、脂漏性皮膚炎、酒さ、抜け毛、乾癬、真皮感染、ウイルス感染、細菌感染、真菌感染、光線性角化症、湿疹性皮膚炎、アトピー性皮膚炎、熱傷、レイノー現象、エリテマトーデス、高色素沈着障害、黒皮症、低色素沈着障害、白斑、皮膚癌、皮膚扁平上皮細胞癌、皮膚基底細胞癌、関節炎、骨関節炎、歯ぎしり、頸痛、乾燥眼、胃腸障害、アカラシア、食道痙攣、胃不全麻痺、オディ括約筋痙攣、裂肛、アニスムス、外側上顆炎、背部痛、腰痛、上背部痛、咬筋肥大、顔面の神経障害、顔面のしわ、額、眉間、顔面および/もしくは眼窩周囲領域に関与するしわ、見苦しい顔面の表情、頸部のしわ、過機能性の顔面のしわ、多動性の顔面のしわ、広頸筋帯、筋痙攣もしくは痙縮に関与する神経筋障害および状態、顔面の麻痺（片側顔面痙攣等）、脳性麻痺、脳卒中による痙縮、眼瞼痙攣、顔面の痙縮、ジストニア、頸部ジストニア、喉頭ジストニア、口下顎ジストニア、書痙、神経痛、三叉神経痛、神経痛、パーキンソン病、足裏の筋膜炎痛、前立腺過形成、頭痛、片頭痛、本態性頭痛、頸椎性頭痛、緊張性頭痛、前立腺障害、前立腺疼痛、前立腺肥大、下肢静止不能症候群、鼻炎、アレルギー性鼻炎、流涎症、皮膚搔痒、斜視、顎関節（「TMJ」）症候群、顔面痙攣、トゥレット症候群、片側顔面痙攣、振戦、本態性振戦、膀胱機能障害、排尿筋・括約筋筋失調、有痛性膀胱、膀胱痙縮、過活動膀胱、腫瘍、痙縮（多発性硬化症に起因するもの等）、後眼窩筋、様々な眼科状態ならびに/またはそれらの組み合わせからなる群から選択される状態または障害、または

(i i i) 望ましくない発汗、臭汗症、体臭、色汗症、座瘡、しわ、頭痛またはそれらの任意の組み合わせ

の処置のために投与されることを特徴とする、請求項12に記載の医薬組成物。

**【請求項14】**

前記医薬組成物が、経口、静注、筋肉内、動脈内、髄内、髄腔内、皮下、心室内、経皮、真皮内、皮内、直腸内、腔内、腹腔内、胃内、局所、粘膜内、鼻腔内、口腔内、腸内、硝子体内、舌下、およびそれらの組み合わせからなる群から選択される送達経路によって投与されることを特徴とする、請求項12に記載の医薬組成物。

**【請求項15】**

前記医薬組成物が、気管内点滴注入法、気管支点滴注入法、吸入、およびそれらの組み合わせからなる群から選択される送達経路によって投与されることを特徴とする、請求項12に記載の医薬組成物。

**【手続補正2】**

**【補正対象書類名】**明細書

**【補正対象項目名】**0005

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

**【0005】**

一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

**(項目1)**

粒子の集団を含むナノ粒子組成物であって、

前記粒子の大部分が約10～約300ナノメートルの直径を有し、

前記ナノ粒子組成物が少なくとも1つの水性分散媒、少なくとも1つの油、および少なくとも1つの界面活性物質を含み、

前記油が中鎖トリグリセリドであり、

前記界面活性物質がポリソルベートであり、

前記界面活性物質に対する油の比率が約0.5：1～約1：1である、  
ナノ粒子組成物。

**(項目2)**

前記中鎖トリグリセリドが6～12個の炭素原子を含む酸である、項目1に記載のナノ粒子組成物。

(項目3)

前記中鎖トリグリセリドが1349オイルである、項目1に記載のナノ粒子組成物。

(項目4)

前記ポリソルベートがポリソルベート80である、項目1に記載のナノ粒子組成物。

(項目5)

前記界面活性物質が、超精製ポリソルベート80である、項目1に記載のナノ粒子組成物。

(項目6)

さらに既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤を含む、項目1に記載のナノ粒子組成物。

(項目7)

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がタンパク質である、項目6に記載のナノ粒子組成物。

(項目8)

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤が抗体である、項目6に記載のナノ粒子組成物。

(項目9)

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がタンパク質複合体である、項目6に記載のナノ粒子組成物。

(項目10)

前記既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤がボツリヌス毒素である、項目6に記載のナノ粒子組成物。

(項目11)

前記ボツリヌス毒素が前記粒子内に被包されている、項目10に記載のナノ粒子組成物。

。(項目12)

前記ボツリヌス毒素が前記粒子の表面上に吸着されている、項目10に記載のナノ粒子組成物。

(項目13)

前記ボツリヌス毒素が前記粒子の界面に会合されている、項目10に記載のナノ粒子組成物。

(項目14)

前記ボツリヌス毒素が、A型、Ab型、Af型、B型、Bf型、C1型、C2型、D型、E型、F型およびG型を含む群から選択される、項目10に記載のナノ粒子組成物。

(項目15)

前記ボツリヌス毒素がA型ボツリヌス毒素である、項目10に記載のナノ粒子組成物。

(項目16)

前記粒子が皮膚を変質または変化させずに該皮膚に浸透可能である、項目1に記載のナノ粒子組成物。

(項目17)

前記粒子が皮膚透過促進剤または表皮剥脱物質を使用せずに皮膚に浸透可能である、項目1に記載のナノ粒子組成物。

(項目18)

前記粒子が皮膚透過促進剤または表皮剥脱物質を使用せずに皮膚上層に浸透可能である、項目1に記載のナノ粒子組成物。

(項目19)

前記皮膚上層が角質層表面である、項目18に記載のナノ粒子組成物。

(項目20)

前記皮膚上層が真皮孔を含む、項目18に記載のナノ粒子組成物。

(項目21)

前記皮膚上層が真皮腺を含む、項目18に記載のナノ粒子組成物。

(項目22)

前記ナノ粒子組成物がパラベンを含まない、項目1～項目21のいずれか1項に記載のナノ粒子組成物。

(項目23)

メチルパラベン、鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化ワックス、およびプロピルパラベンを含むローション。

(項目24)

さらにポリソルベート80、1349オイル、またはそれらの組み合わせを含む、項目23に記載のローション。

(項目25)

前記ローションが互いに混合した2相を含み、前記第1相がメチルパラベンを含む、項目23に記載のローション。

(項目26)

前記ローションが互いに混合した2相を含み、前記第2相が鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化ワックス、およびプロピルパラベンを含む、項目23に記載のローション。

(項目27)

前記ローションが互いに混合した2相を含み、前記第1相がメチルパラベンを含み、前記第2相が鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、乳化ワックス、およびプロピルパラベンを含む、項目23に記載のローション。

(項目28)

鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、および乳化ワックスを含むローション。

(項目29)

さらにポリソルベート80、1349オイル、またはそれらの組み合わせを含む、項目28に記載のローション。

(項目30)

前記ローションが互いに混合した2相を含み、前記第2相が鉛油、ミリスチン酸イソプロピル、白色ワセリン、および乳化ワックスを含む、項目28に記載のローション。

(項目31)

項目23～項目30のいずれか1項に記載のローションおよび既知の治療薬または独立して活性である生物学的に活性な薬剤を含む医薬組成物。

(項目32)

項目1～項目21のいずれか1項に記載のナノ粒子組成物およびローションを含む医薬組成物。

(項目33)

項目1～項目21のいずれか1項に記載のナノ粒子組成物および項目23～項目30のいずれか1項に記載のローションを含む医薬組成物。

(項目34)

前記医薬組成物が脱臭剤に製剤化される、項目31～項目33のいずれかの医薬組成物。

(項目35)

前記医薬組成物が制汗薬に製剤化される、項目31～項目33のいずれかの医薬組成物。

(項目36)

対象を提供するステップと、

項目1～項目21のいずれか1項に記載のナノ粒子組成物、項目23～項目30のいずれか1項に記載のローション、もしくは項目31～項目33のいずれか1項に記載の医薬組成物を前記対象の皮膚に投与するステップと、

を含む方法。

(項目37)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、皮脂腺に関連する状態または障害処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目38)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、汗腺に関連する状態または障害処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目39)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、毛包に関連する状態または障害処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目40)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、皮膚の外層処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目41)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を、座瘡、多汗症、望ましくない発汗、臭汗症、体臭、色汗症、過剰皮脂産出障害、脂漏症、脂漏性皮膚炎、酒さ、抜け毛、乾癬、真皮感染、ウイルス感染、細菌感染、真菌感染、光線性角化症、湿疹性皮膚炎、アトピー性皮膚炎、熱傷、レイノー現象、エリテマトーデス、高色素沈着障害、黒皮症、低色素沈着障害、白斑、皮膚癌、皮膚扁平上皮細胞癌、皮膚基底細胞癌、関節炎、骨関節炎、歯ぎしり、頸痛、乾燥眼、胃腸障害、アカラシア、食道痙攣、胃不全麻痺、オディ括約筋痙攣、裂肛、アニスムス、外側上顆炎、背部痛、腰痛、上背部痛、咬筋肥大、顔面の神経障害、顔面のしわ、額、眉間、顔面および／もしくは眼窩周囲領域に関与するしわ、見苦しい顔面の表情、頸部のしわ、過機能性の顔面のしわ、多動性の顔面のしわ、広頸筋帯、筋痙攣もしくは痙縮に関与する神経筋障害および状態、顔面の麻痺（片側顔面痙攣等）、脳性麻痺、脳卒中による痙縮、眼瞼痙攣、顔面の痙縮、ジストニア、頸部ジストニア、喉頭ジストニア、口下顎ジストニア、書痙、神経痛、三叉神経痛、神経痛、パーキンソン病、足裏の筋膜炎痛、前立腺過形成、頭痛、片頭痛、本態性頭痛、頸椎性頭痛、緊張性頭痛、前立腺障害、前立腺疼痛、前立腺肥大、下肢静止不能症候群、鼻炎、アレルギー性鼻炎、流涎症、皮膚搔痒、斜視、顎関節（「TMJ」）症候群、顔面痙攣、トウレット症候群、片側顔面痙攣、振戦、本態性振戦、膀胱機能障害、排尿筋・括約筋筋失調、有痛性膀胱、膀胱痙縮、過活動膀胱、腫瘍、痙縮（多発性硬化症に起因するもの等）、後眼窓筋、様々な眼科状態ならびに／またはそれらの組み合わせからなる群から選択される状態または障害処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目42)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を望ましくない発汗処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目43)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を臭汗症処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目44)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を体臭処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目45)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を色汗症処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目46)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を座瘡処置のために投与する、項目36に記載の方法。

(項目47)

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物をしわ処置のために投与する、項

目 3 6 に記載の方法。

( 項目 4 8 )

前記ナノ粒子組成物、ローション、または医薬組成物を頭痛処置のために投与する、項目 3 6 に記載の方法。

( 項目 4 9 )

項目 1 ~ 項目 2 1 のいずれか 1 項に記載のナノ粒子組成物および薬学的に許容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

( 項目 5 0 )

前記組成物が注射用に製剤化される、項目 4 9 に記載の医薬組成物。

( 項目 5 1 )

前記組成物が経口投与用に製剤化される、項目 4 9 に記載の医薬組成物。

( 項目 5 2 )

対象を提供するステップと、

項目 1 ~ 項目 2 1 のいずれか 1 項に記載のナノ粒子組成物もしくは項目 4 9 ~ 項目 5 1 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物を対象に投与するステップと、  
を含む方法。

( 項目 5 3 )

前記投与するステップが、経口、静注、筋肉内、動脈内、髄内、髄腔内、皮下、心室内、経皮、真皮内、皮内、直腸内、膣内、腹腔内、胃内、局所、粘膜内、鼻腔内、口腔内、腸内、硝子体内、舌下、およびそれらの組み合わせからなる群から選択される送達経路を含む、項目 5 2 に記載の方法。

( 項目 5 4 )

前記投与するステップが、気管内点滴注入法、気管支点滴注入法、吸入、およびそれらの組み合わせからなる群から選択される送達経路を含む、項目 5 2 に記載の方法。

本発明は、本明細書中に記載されるような特定の組成物を提供する。