

【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28年8月4日 (2016.8.4)

【公表番号】特表2015-520236(P2015-520236A)

【公表日】平成27年7月16日 (2015.7.16)

【年通号数】公開・登録公報2015-045

【出願番号】特願2015-518528(P2015-518528)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/57 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/565 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 15/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/57

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/34

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/565

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 15/12

A 6 1 K 9/70

【手続補正書】

【提出日】平成28年6月17日 (2016.6.17)

【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】

プロゲステロンを含む経皮吸収型製剤であって、前記プロゲステロンが、中鎖脂肪酸グリコールエステル又はグリセロールエステルで可溶化され、前記可溶化プロゲステロンが、経皮吸収型のパッチに存在する、経皮吸収型製剤。

【請求項 2】

前記中鎖脂肪酸グリコールエステル又はグリセロールエステルが、グリセロール、ポリエチレングリコール、若しくはプロピレングリコールの中鎖脂肪酸エステル、又はそれらの混合物であり、前記中鎖脂肪酸は主に、

C 6 ~ C 12 脂肪酸、

C 6 ~ C 10 脂肪酸、

C 8 ~ C 12 脂肪酸、又は

C 8 ~ C 10 脂肪酸である、請求項 1 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 3】

前記中鎖脂肪酸グリコールエステル又はグリセロールエステルが、主に飽和している、請求項 1 又は 2 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 4】

前記中鎖脂肪酸グリコールエステル又はグリセロールエステルが、C 8 ~ C 12 飽和脂肪酸を主に含む、請求項 3 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 5】

非イオン性界面活性剤を更に含む、請求項 1 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 6】

前記プロゲステロンが、C 8 ~ C 10 脂肪酸モノグリセリド、ジグリセリド、又はトリグリセリド、及び前記非イオン性界面活性剤で可溶化されている、請求項 5 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 7】

前記プロゲステロンが、C 8 脂肪酸モノグリセリド及びジグリセリド、並びに前記非イオン性界面活性剤で可溶化されている、請求項 6 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 8】

前記プロゲステロンが、C 8 及び C 10 トリグリセリド並びに非イオン性界面活性剤で可溶化されている、請求項 6 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 9】

前記非イオン性界面活性剤が、ポリエチレングリコールの脂肪酸エステルを含む、請求項 6 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 10】

前記プロゲステロンの1日当たりの投与量が、パッチあたり 10 ~ 100 mg である、請求項 1 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 11】

17 - エストラジオールを更に含む、請求項 1 ~ 9 の何れか 1 項に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 12】

前記 17 - エストラジオールが可溶化されている、請求項 11 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 13】

前記 17 - エストラジオールの 1 日当たりの投与量が、パッチあたり 0.01 ~ 0.1 mg である、請求項 1 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 14】

プロゲステロンを含む経皮吸収型製剤であって、前記プロゲステロンが、中鎖脂肪酸グリコールエステル又はグリセロールエステル及び非界面活性剤で可溶化され、前記中鎖脂肪酸グリコールエステル又はグリセロールエステルが、グリセロール、ポリエチレングリコール、若しくはプロピレングリコールの中鎖脂肪酸エステル、又はそれらの混合物であり、前記中鎖脂肪酸は主に飽和された、

C 6 ~ C 12 脂肪酸、

C 6 ~ C 10 脂肪酸、

C 8 ~ C 12 脂肪酸、又は

C 8 ~ C 10 脂肪酸であり、

前記可溶化プロゲステロンが、経皮パッチ中に存在する、経皮吸収型製剤。

【請求項 15】

前記中鎖脂肪酸グリコールエステル又はグリセロールエステルが、C 8 ~ C 12 飽和脂肪酸を主に含む、請求項 14 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 9 及び請求項 14 ~ 15 の何れか 1 項に記載の経皮吸収型製剤であって、前記経皮吸収型製剤が、治療を必要とする哺乳類における、プロゲステロン不足状態の少なくとも 1 種の治療に用いられ、前記治療が、経皮吸収型製剤を有効量で投与することを含む、経皮吸収型製剤。

【請求項 17】

請求項 11 又は 12 に記載の経皮吸収型製剤であって、前記経皮吸収型製剤が、治療を必要とする哺乳類における、プロゲステロン不足状態の少なくとも 1 種及びエストロゲン不足状態の少なくとも 1 種の治療に用いられ、前記治療が、経皮吸収型製剤を有効量で投与することを含む、経皮吸収型製剤。

【請求項 18】

前記プロゲステロン及び 17 - エストラジオールが、周期的順次的方法で投与される、請求項 17 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 19】

前記プロゲステロン及び 17 - エストラジオールが、周期的併用方法で投与される、請求項 17 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 20】

(i) プロゲステロンを約 7 . 1 4 重量 %、17 - エストラジオールを約 0 . 2 9 重量 %、カプリル酸及びカプリン酸のモノグリセリド / ジグリセリド / トリグリセリド (例えば、Capmul MCM) を約 8 2 . 5 7 重量 %、ラウロイルポリオキシ - 3 2 - グリセリド (例えば、Gelucire 44 / 14) を約 1 0 重量 % ;

(i i) プロゲステロンを約 7 . 3 4 重量 %、17 - エストラジオールを約 1 . 2 重量 %、及びカプリル酸及びカプリン酸のモノグリセリド / ジグリセリド / トリグリセリド (例えば、Capmul MCM) を約 9 1 . 4 6 重量 % ; または

(i i i) プロゲステロンを約 9 . 5 0 重量 %、17 - エストラジオールを約 1 . 2 重量 %、及びプロピレングリコールモノカプリレート (例えば、Capmul PG8) を約 8 9 . 3 0 重量 % ;

からなる、請求項 11 に記載の経皮吸収型製剤。