

【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 1 2 脂肪酸、

C 6 ~ C 1 0 脂肪酸、

C 8 ~ C 1 2 脂肪酸、又は

C 8 ~ C 1 0 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10～100mg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0.01～0.1mg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 1 1 又は 1 2 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 1 8】

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 1 7 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 1 9】

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 1 7 に記載の経皮吸収型製剤。

【請求項 2 0】

( 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 % ；

( ii ) 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

( iii ) 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 1 1 に記載の経皮吸収型製剤。