

【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29年2月9日(2017.2.9)

【公表番号】特表2016-505006(P2016-505006A)

【公表日】平成28年2月18日(2016.2.18)

【年通号数】公開・登録公報2016-011

【出願番号】特願2015-550784(P2015-550784)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/57 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 P 15/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/565 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/57

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 15/18

A 6 1 K 31/565

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 9/06

【手続補正書】

【提出日】平成28年12月22日(2016.12.22)

【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】

局所的適用のための柔軟な有限システムの形態にある、レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを経皮送達するための経皮薬物送達システムであって、レボノルゲストレル、エチニルエストラジオール、及びアクリル系ポリマーを含有するポリマーマトリックスを含み、該アクリル系ポリマーが、ヒドロキシ官能性アクリル系ポリマーを含むことを特徴とする、前記経皮薬物送達システム。

【請求項2】

前記ポリマーマトリックスが、ポリビニルピロリドン(PVP)及びポリビニルピロリドン/酢酸ビニル(PVP/VA)を実質的に含まない、請求項1記載の経皮薬物送達システム。

【請求項3】

前記ポリマーマトリックスが、ポリビニルピロリドン(PVP)及びポリビニルピロリドン/酢酸ビニル(PVP/VA)を含まない、請求項1又は2に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項4】

浸透促進剤を更に含む、請求項1～3の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項5】

前記ポリマーマトリックスが、0.1～3%のレボノルゲストレル、0.1～5%のエチニルエストラジオール、5-20%の浸透促進剤、及び適量のアクリル系ポリマーを含む、請求項1～4の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項6】

前記浸透促進剤が、グリセリルモノオレエート、ジプロピレングリコール、及びこれらの混合物からなる群から選択される、請求項4又は5に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項7】

少なくとも3日、少なくとも4日、又は少なくとも7日間の期間に渡り、レボノルゲストレルの持続送達を実現するのに十分な量のレボノルゲストレルを含む、請求項1～6の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項8】

少なくとも3日、少なくとも4日、又は少なくとも7日間の期間に渡り、エチニルエストラジオールの持続送達を実現するのに十分な量のエチニルエストラジオールを含む、請求項1～7の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項9】

裏地層を更に含む、請求項1～8の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項10】

剥離ライナーを更に含む、請求項1～9の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項11】

レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを、これらを必要とする対象に、経皮送達する方法において使用するための、請求項1～10の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項12】

避妊を必要とする女性対象における避妊を提供する方法において使用するための、請求項1～11の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

【請求項13】

レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを経皮送達する方法であって、請求項1～12の何れか1項に記載の経皮薬物送達システムを、該システムを必要とする非ヒト対象の皮膚又は粘膜に適用する工程を含む、前記方法。

【請求項14】

前記経皮薬物送達システムが、7日までの期間に渡り適用される、請求項13に記載の方法。

【請求項15】

局所的適用のための柔軟な有限システムの形態にある、レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを含む経皮薬物送達システムの製造方法であって、レボノルゲストレル、エチニルエストラジオール、及びアクリル系ポリマーを含むポリマーマトリックスを製造する工程を含むことを特徴とする、前記方法。

【請求項16】

レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを経皮送達するための薬剤の製造における、レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールの使用であって、該薬剤がレボノルゲストレル、エチニルエストラジオール、及びアクリル系ポリマーを含むポリマーマトリックスを含有する、柔軟な有限システムの形態にあることを特徴とする、前記使用。

【請求項17】

避妊を提供するための薬剤の製造におけるレボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールの使用であって、該薬剤がレボノルゲストレル、エチニルエストラジオール、及びアクリル系ポリマーを含むポリマーマトリックスを含有する、柔軟な有限システムの形態にあることを特徴とする、前記使用。

【請求項 18】

前記ポリマーマトリックスが、少なくとも3日、少なくとも4日、又は少なくとも7日間の期間に渡り、レボノルゲストレルの持続送達を実現するのに十分な量のレボノルゲストレルを含み、且つ、少なくとも3日、少なくとも4日、又は少なくとも7日間の期間に渡り、エチニルエストラジオールの持続送達を実現するのに十分な量のエチニルエストラジオールを含む、請求項 16 に記載の使用。

【請求項 19】

前記ポリマーマトリックスが、少なくとも3日、少なくとも4日、又は少なくとも7日間の期間に渡り、レボノルゲストレルの持続送達を実現するのに十分な量のレボノルゲストレルを含み、且つ、少なくとも3日、少なくとも4日、又は少なくとも7日間の期間に渡り、エチニルエストラジオールの持続送達を実現するのに十分な量のエチニルエストラジオールを含む、請求項 17 に記載の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0043

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0043】

インビトロフラックス研究を、フランツ(Franz)セル装置を使用し、ヒト死体皮膚を用いて行って、160時間(約7日)の期間に渡る、該マトリックスからのエチニルエストラジオールのフラックスを測定した。結果をオルトエブラ(OrthoEvra(登録商標)())と比較して、図3に示す(、 、 -x-)。これらのデータは、上記ポリマーマトリックス中のエチニルエストラジオール量を選択し、かつ調節することによって、エチニルエストラジオールのフラックスを選択し、かつ調節し得ることを示している。

本発明の好ましい態様は、下記の通りである。

〔1〕局所的適用のための柔軟な有限システムの形態にある、レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを経皮送達するための経皮薬物送達システムであって、レボノルゲストレル、エチニルエストラジオール、及びアクリル系ポリマーを含有するポリマーマトリックスを含み、該アクリル系ポリマーが、ヒドロキシ官能性アクリル系ポリマーを含むことを特徴とする、前記経皮薬物送達システム。

〔2〕前記ポリマーマトリックスが、ポリビニルピロリドン(PVP)及びポリビニルピロリドン/酢酸ビニル(PVP/VA)を実質的に含まない、前記〔1〕記載の経皮薬物送達システム。

〔3〕前記ポリマーマトリックスが、ポリビニルピロリドン(PVP)及びポリビニルピロリドン/酢酸ビニル(PVP/VA)を含まない、前記〔1〕又は〔2〕に記載の経皮薬物送達システム。

〔4〕浸透促進剤を更に含む、前記〔1〕～〔3〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

〔5〕前記ポリマーマトリックスが、0.1～3%のレボノルゲストレル、0.1～5%のエチニルエストラジオール、5-20%の浸透促進剤、及び適量のアクリル系ポリマーを含む、前記〔1〕～〔4〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

〔6〕前記浸透促進剤が、グリセリルモノオレート、ジプロピレングリコール、及びこれらの混合物からなる群から選択される、前記〔4〕又は〔5〕に記載の経皮薬物送達システム。

〔7〕少なくとも3日、少なくとも4日、又は少なくとも7日間の期間に渡り、レボノルゲストレルの持続送達を実現するのに十分な量のレボノルゲストレルを含む、前記〔1〕～〔6〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

〔8〕少なくとも3日、少なくとも4日、又は少なくとも7日間の期間に渡り、エチニルエストラジオールの持続送達を実現するのに十分な量のエチニルエストラジオールを含む、前記〔1〕～〔7〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

〔9〕裏地層を更に含む、前記〔1〕～〔8〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム

°

〔 1 0 〕剥離ライナーを更に含む、前記〔 1 〕～〔 9 〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

〔 1 1 〕レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを、これらを必要とする対象に、経皮送達する方法において使用するための、前記〔 1 〕～〔 10 〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

〔 1 2 〕避妊を必要とする女性対象における避妊を提供する方法において使用するための、前記〔 1 〕～〔 11 〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システム。

〔 1 3 〕レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを経皮送達する方法であって、前記〔 1 〕～〔 12 〕の何れか1項に記載の経皮薬物送達システムを、該システムを必要とする対象の皮膚又は粘膜に適用する工程を含む、前記方法。

〔 1 4 〕前記対象がヒトの女性対象である、前記〔 13 〕に記載の方法。

〔 1 5 〕前記方法が、避妊のためである、前記〔 13 〕に記載の方法。

〔 1 6 〕前記経皮薬物送達システムが、7日までの期間に渡り適用される、前記〔 13 〕～〔 15 〕の何れか1項に記載の方法。

〔 1 7 〕局所的適用のための柔軟な有限システムの形態にある、レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを含む経皮薬物送達システムの製造方法であって、レボノルゲストレル、エチニルエストラジオール、及びアクリル系ポリマーを含むポリマーマトリックスを製造する工程を含むことを特徴とする、前記方法。

〔 1 8 〕レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールを経皮送達するための薬剤の製造における、レボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールの使用であって、該薬剤がレボノルゲストレル、エチニルエストラジオール、及びアクリル系ポリマーを含むポリマーマトリックスを含有する、柔軟な有限システムの形態にあることを特徴とする、前記使用。

〔 1 9 〕避妊を提供するための薬剤の製造におけるレボノルゲストレル及びエチニルエストラジオールの使用であって、該薬剤がレボノルゲストレル、エチニルエストラジオール、及びアクリル系ポリマーを含むポリマーマトリックスを含有する、柔軟な有限システムの形態にあることを特徴とする、前記使用。