

【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2011-502173(P2011-502173A)

【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2010-532377(P2010-532377)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/568 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/568

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 5/24

A 6 1 K 45/00

【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】

生理活性剤および浸透促進剤を含む組成物を含む経皮送達システムであって、該浸透促進剤が (i) サリチル酸の $C_6 - C_{30}$ 脂肪族エステル、および (i i) 平均分子量 300 以下のポリエチレングリコール (P E G) の組み合わせを含む経皮送達システム。

【請求項 2】

サリチル酸のエステルが $C_6 - C_{12}$ アルキルエステルである、請求項 1 の経皮送達システム。

【請求項 3】

サリチル酸のエステルがエチルヘキシルエステルである、請求項 1 または請求項 2 の経皮送達システム。

【請求項 4】

サリチル酸のエステルが全経皮組成物の 0.1 ~ 10 重量 % の量にて存在する、請求項 1 または請求項 2 の経皮送達システム。

【請求項 5】

平均分子量 300 以下の PEG が全組成物の 0.1 ~ 40 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 6】

平均分子量 300 以下のポリエチレングリコールに対するサリチル酸のエステルの重量比が 1 : 10 ~ 10 : 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 7】

組成物が $C_2 - C_4$ アルカノールから選択される揮発性溶媒を含む、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 8】

揮発性溶媒が全組成物の 70 重量% ~ 95 重量%の範囲の量にて組成物中に存在する、請求項 7 の経皮送達システム。

【請求項 9】

組成物が本質的に、

- (i) 1 つ以上の生理活性剤を含んでよい生理活性成分；
 - (ii) サリチル酸のエステルおよび平均分子量 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；
 - (iii) 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
 - (iv) 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 10】

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 11】

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 12】

活性剤に対する浸透促進剤の重量比が 500 : 1 ~ 1 : 10 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 13】

生理活性剤が抗うつ薬、女性の健康増進剤 (women's health actives) および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 14】

生理活性剤がミルタザピン、その代謝物、塩、エナンチオマー (エスミルタザピンを含む)、溶媒、非共有結合複合体、キレート、水和物、結晶または非結晶型の 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 15】

生理活性剤が、アンドロゲン、エストロゲン、選択的エストロゲン受容体修飾因子、アロマターゼ阻害剤、ゴナドトロピン、プロゲステロン、プロゲスチン、選択的プロゲステロン受容体修飾因子、抗プロゲステゲン剤、抗ゴナドトロピン剤、GnRH: (受容体) 作動薬、抗下痢剤、心血管系薬剤、降圧剤、カルシウムチャネル遮断薬、プロトンポンプ阻害剤、抗不整脈薬、抗狭心症薬、 α -アドレナリン作動性遮断薬、強心配糖体、アドレナリン作動性刺激薬、血管拡張薬、抗片頭痛製剤、抗凝血剤、止血剤、鎮痛薬、解熱薬、睡眠薬、抗不安薬、神経遮断薬および抗精神病薬、抗うつ薬、カフェインなどの CNS 刺激薬、アルツハイマー病治療薬、パーキンソン病治療薬、脂質調節薬、抗痙攣薬、制吐薬、鎮吐薬、非ステロイド系抗炎症薬、抗リウマチ薬、筋弛緩薬、痛風および高尿酸血症に用いられる薬剤、利尿薬、抗利尿薬、分娩薬、プロスタグランジン、抗菌薬、抗結核薬、抗マラリア薬、抗ウイルス薬、駆虫薬、細胞毒性薬、食欲抑制薬、高カルシウム血症に用いられる薬剤、鎮咳薬、去痰薬、鬱血除去薬、気管支痙攣弛緩薬、抗ヒスタミン薬、局所

麻酔薬、角質層脂質、H₂-受容体拮抗薬、神経筋遮断薬、禁煙薬、殺虫剤および他の駆除剤、皮膚病薬、アレルゲン、栄養補助活性化合物 (nutraceutically active compounds)、角質溶解薬、精神賦活薬、抗ニキビ薬、抗乾癬薬、かゆみ止め薬、抗コリン薬、ならびにその混合物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16】

これらの群の1つ以上から選択される複数のホルモンを含み、好ましくは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避妊活性剤を含む、請求項13の経皮送達システム。

【請求項17】

薬物送達システムが重量ベースで0.1~10%のホルモン、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18】

動物対象への活性剤の経皮投与のための、前述の請求項のいずれか1項の経皮送達システムであって、動物の皮膚表面へ適用される経皮送達システム。

【請求項19】

動物の皮膚表面の部位に薬剤を適用することによる動物に対する生理活性剤の経皮投与の生理活性剤を含む薬剤の製造における、(i)サリチル酸のC₆-C₃₀脂肪族エステル、および(ii)(平均分子量300以下の)ポリエチレングリコールの使用。

【請求項20】

動物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用のテストステロンなどのアンドロゲンを用いたアンドロゲン補充療法、男性避妊および女性避妊を必要としている、請求項19の使用。

【請求項21】

動物の皮膚表面の部位への投与用の経皮送達システムの製造方法であって、生理活性剤、ならびに第1の浸透促進成分としてサリチル酸のC₆-C₃₀脂肪族エステル、および第2の浸透促進成分として平均分子量300以下のポリエチレングリコールを組み合わせることを含む製造方法。

【請求項22】

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1~17のいずれか1項の経皮送達システム。