

【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26年2月13日(2014.2.13)

【公表番号】特表2013-515018(P2013-515018A)

【公表日】平成25年5月2日(2013.5.2)

【年通号数】公開・登録公報2013-021

【出願番号】特願2012-545090(P2012-545090)

【国際特許分類】

A 61 K 31/59 (2006.01)  
A 61 K 31/593 (2006.01)  
A 61 K 31/592 (2006.01)  
A 61 K 9/107 (2006.01)  
A 61 K 47/14 (2006.01)  
A 61 K 47/34 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (2006.01)  
A 61 P 17/06 (2006.01)  
A 61 P 17/08 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 K 31/573 (2006.01)  
A 61 K 31/192 (2006.01)  
A 61 K 31/405 (2006.01)  
A 61 K 31/196 (2006.01)  
A 61 K 31/5415 (2006.01)  
A 61 K 31/542 (2006.01)  
A 61 K 31/121 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
A 61 K 47/06 (2006.01)  
A 61 K 47/10 (2006.01)  
A 61 K 47/26 (2006.01)  
A 61 K 47/22 (2006.01)  
A 61 P 3/02 (2006.01)

【F I】

A 61 K 31/59  
A 61 K 31/593  
A 61 K 31/592  
A 61 K 9/107  
A 61 K 47/14  
A 61 K 47/34  
A 61 P 17/00  
A 61 P 17/06  
A 61 P 17/08  
A 61 P 29/00  
A 61 K 31/573  
A 61 K 31/192  
A 61 K 31/405  
A 61 K 31/196  
A 61 K 31/5415  
A 61 K 31/542  
A 61 K 31/121

A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 K 47/06  
A 6 1 K 47/10  
A 6 1 K 47/26  
A 6 1 K 47/22  
A 6 1 P 3/02 1 0 2

【手続補正書】

【提出日】平成25年12月17日(2013.12.17)

【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】

(a) 親水性非イオン性界面活性剤；

(b) 親油性非イオン性共界面活性剤；

(c) 両親媒性でも非両親媒性でもよいC<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>アシルグリセリド；

の等方性の溶媒混合物を約1～20重量%含む、皮膚適用のための実質的に無水の医薬組成物であって、

該等方性の溶媒混合物は過剰の水が存在する状態でマイクロエマルジョンを形成することができ；

さらに該等方性の溶媒混合物に溶解または可溶化されたビタミンD誘導体または類似体および

薬学的に許容される、実質的に無水の脂質担体を含む、組成物。

【請求項2】

ビタミンD類似体がカルシポトリオールまたはカルシポトリオール水和物である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

等方性の混合物における界面活性剤の量が混合物の約10～約70重量%、特に約30重量%～約60重量%、例えば約40～約50重量%である、請求項1または2に記載の組成物。

【請求項4】

親水性界面活性剤が少なくとも20モルのエチレンオキシド基/1モルのグリセリドを含む植物油のポリエチレングリコールエステルであり、かかるエステルは、ポリオキシエチレン・ヒマシ油誘導体、例えば、PEG20、30、35、38、40、50または60ヒマシ油またはPEG20、25、30、40、45、50、60または80硬化ヒマシ油、PEG20または60トウモロコシグリセリド、PEG20または60アーモンドグリセリドまたはPEG40パーム核油から成る群から選択される、請求項3に記載の組成物。

【請求項5】

等方性の混合物における非イオン性共界面活性剤の量が、混合物の約10～約50重量%、特に約20～約40重量%、例えば約25～約30重量%である、請求項1～4のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項6】

親油性共界面活性剤がC<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>脂肪酸のモノグリセリドエステル、例えばグリセリルモノカプリレート、グリセリルモノカブレート、グリセリルモノステアレート、グリセリルモノベヘナート、C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>脂肪酸のジグリセリドエステル、例えば、グリセリルジラ

ウレート、C<sub>6</sub> - 2 2 脂肪酸のモノ - およびジ - グリセリドエステル、例えばカプリル酸 / カプリン酸モノ - およびジ - グリセリドまたはグリセリルモノ - およびジリシノレート、C<sub>6</sub> - 2 2 脂肪酸エステルのプロピレングリコールエステル、例えばプロピレングリコールモノカブリレートまたはプロピレングリコールモノラウレート、ジアルキレングリコールモノアルキルエーテル、例えばジエチレングリコールモノエチルエーテル、ポリグルセリル C<sub>6</sub> - 2 2 脂肪酸エステル、例えば、ポリグルセリル - 3 - ジイソステアレート、4 - 8 モルのエチレンオキシド基 / 1 モルのグリセリドを含むトリグリセリド / 植物油のポリエチレングリコールエステル、例えば PEG - 6 トウモロコシ油、PEG - 6 扁桃油、PEG - 6 杏仁油、PEG - 6 オリーブオイル、PEG - 6 落花生油、PEG - 6 パーム核油水素と化合したパーム核油、PEG - 6 トリオレインまたはPEG - 8 トウモロコシ油から成る群から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

等方性の溶媒混合物における C<sub>6</sub> - 2 2 アシルグリセリドの量が、混合物の約 10 ~ 約 70 重量%、例えば約 15 ~ 約 40 重量%、例えば約 20 ~ 約 30 重量%である、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 8】

C<sub>6</sub> - 2 2 アシルグリセリドが中鎖トリグリセリド、長鎖トリグリセリドまたはヒマシ油のような極めて純粋な植物油から成る群から選択される非両親媒性の C<sub>6</sub> - 2 2 アシルグリセリドまたはカプリル酸 / カプリン酸モノ - およびジ - グリセリドおよびカプリル酸 / カプリン酸モノ - 、ジ - およびトリグリセリドから成る群から選択される両親媒性の C<sub>6</sub> - 2 2 アシルグリセリドである、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 9】

界面活性剤 : 共界面活性剤 : C<sub>6</sub> - 2 2 アシルグリセリドの比率が 2 : 1 : 1 である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】

等方性の溶媒混合物が組成物の約 5 ~ 15 重量% または約 8 ~ 12 重量% または約 9 ~ 11 重量、例えば約 10 重量% を構成する、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 11】

C<sub>6</sub> - 2 2 アシルグリセリドが中鎖トリグリセリドであり、界面活性剤がポリオキシル 4 0 硬化ヒマシ油であり、共界面活性剤がカプリル酸 / カプリン酸モノ - およびジ - グリセリドであるかまたは C<sub>6</sub> - 2 2 アシルグリセリドが長鎖トリグリセリドであり、界面活性剤がポリオキシル 4 0 硬化ヒマシ油であり、共界面活性剤がカプリル酸 / カプリン酸モノ - およびジ - グリセリドである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

脂質担体が、C<sub>5</sub> から C<sub>6</sub> 0 の鎖長であって、C<sub>14</sub> - 1 6 、 C<sub>18</sub> - 2 2 、 C<sub>20</sub> - 2 2 、 C<sub>20</sub> - 2 6 がピークの鎖長を有する炭化水素またはその混合物から成るパラフィン類(ガスクロマトグラフィーにより決定)から選択される少なくとも一個のパラフィンを含む、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 13】

約 0.001 ~ 0.5 mg / g、好ましくは約 0.002 ~ 0.25 mg / g、特に 0.005 ~ 0.05 mg / g のビタミン D 誘導体または類似体を含む、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 14】

0.003 - 0.008 % w / w のカルシポトリオール - 水和物

2 - 3 % w / w 中鎖または長鎖トリグリセリド

2 - 3 % w / w カプリル酸 / カプリン酸モノ - およびジ - グリセリド

4 - 6 % w / w PEG 4 0 硬化ヒマシ油

0.5 - 1.5 % w / w トリエタノールアミン

85 - 95 % w / w パラフィン担体

を含む、請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 15】

さらに 1 種以上の治療上活性な成分を含む、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 16】

さらなる活性成分がコルチコステロイドのような抗炎症剤、例えば、ベタメタゾンおよびそのエステル、例えば吉草酸またはジプロピオン酸エステル、クロベタゾールまたはそのエステル、例えばプロピオン酸エステル、ヒドロコルチゾンまたはそのエステル、例えば酢酸エステル；ナプロキセン、インドメタシン、ジクロフェナク、イブプロフェン、デクスイブプロフェン、ケトプロフェン、フルルビプロフェン、ピロキシカム、テノキシカム、ロルノキシカムまたはナブメトンのような非ステロイド性抗炎症剤、ホスホジエステラーゼ 4 阻害剤または p 38 MAP キナーゼ阻害剤から選択される、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

さらなる活性成分がベタメタゾンまたはそのエステル、例えば吉草酸またはジプロピオン酸エステルである、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

さらなる活性成分がホスホジエステラーゼ 4 阻害剤である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 19】

皮膚の疾患または症状の治療で使用される、請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 20】

乾癬、脂漏性乾癬、手掌足底膿疱症、皮膚炎、魚鱗癬、酒さまたはざ瘡から成る群から選択される皮膚疾患または状態の処置に使用するための、請求項 19 に記載の組成物。