

第50号

出典：ニトロイミダゾールゲル組成物

国際公開番号：WO98/27960
(抜粋)

・ 出願人：バイオگران アイランド

・ 発明者：2名

2頁：6 . 製薬的活性剤が、**ニトロイミダゾール薬**である請求項1から4のいずれかの1項記載方法。

2頁：7 . **ニトロイミダゾール薬**が、**メトロニダゾール**又は**チニダゾール**、好ましくは**メトロニダゾル**である請求項6記載の方法。

3頁：30 . 皮膚状態が、**しゅさ**、**湿疹**であり、又は**抗菌活性ニトロイミダゾール**、好ましくは**メトロニダゾル**に応答する感染を含む請求項20から29のいずれか1項記載の組成物。

3頁：36 . **乾癬**又は**炎症化した皮膚**を含んだ皮膚状態、好ましくは、**しゅさ**、**湿疹**、又は**抗菌活性ニトロイミダゾール**、好ましくは**メトロニダゾル**に応答する感染を含む状態を治療する方法であり、請求項20～32のいずれか1項記載の組成物を局部的に適用する事を備える方法。

(書誌+要約+請求の範囲)

- (19)【発行国】日本国特許庁(JP)
 (12)【公報種別】公表特許公報(A)
 (11)【公表番号】特表2001-507018(P2001-507018A)
 (43)【公表日】平成13年5月29日(2001. 5. 29)
 (54)【発明の名称】ニトロイミダゾールゲル組成物
 (51)【国際特許分類第7版】

A61K 9/00

【F1】

A61K 9/00

【審査請求】未請求

【予備審査請求】有

【全頁数】27

- (21)【出願番号】特願平10-528544
 (86)(22)【出願日】平成9年12月19日(1997. 12. 19)
 (85)【翻訳文提出日】平成11年6月17日(1999. 6. 17)
 (86)【国際出願番号】PCT/GB97/03512
 (87)【国際公開番号】WO98/27960
 (87)【国際公開日】平成10年7月2日(1998. 7. 2)
 (31)【優先権主張番号】9626513. 7
 (32)【優先日】平成8年12月20日(1996. 12. 20)
 (33)【優先権主張国】イギリス(GB)
 (81)【指定国】EP(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, S E), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AP(GH, GM, K E, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), AL, AM, A T, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, G H, GM, GW, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, M D, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, T M, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW
 (71)【出願人】
 【氏名又は名称】バイオگران アイランド(アール アンド デイ)リミテッド
 【住所又は居所】アイランド国 ダブリン 13 バルドイレ インダストリアル エステイト 151 ユニット 5
 (72)【発明者】
 【氏名】グッドマン, マイケル
 【住所又は居所】イギリス国 ベッドフォードシャー MK45 2XE アンプトヒル ラッシュブルック クロース 30
 (72)【発明者】
 【氏名】リンダー, アーケ
 【住所又は居所】スウェーデン国 S-274 33 スクルップ リングドゥヴェヴァーゲン 50
 (74)【代理人】
 【弁理士】
 【氏名又は名称】志賀 正武 (外1名)

(57)【要約】

抗菌活性ニトロイミダゾール薬、水混和性アルキレングリコール、ヒドロキシアルキルセルロースゲル化剤及び水とを含み、生理学的に許容されるpHを有するように緩衝化された、乾燥または炎症化した皮膚を含む皮膚条件の局部治療において使用するための粘性ヒドロゲル組成物及びそれを作製する方法。

【特許請求の範囲】

1. 製薬的活性剤、ポリサッカリド、水混和性有機溶媒および水を備える粘性ヒドロゲル組成物の調製方法であり、該水混和性有機溶媒中に該ポリサッカリドを懸濁すること、及び水性媒体の中に得られた懸濁物を混合し、それによって該ポリサッカリドを水和し且つ粘性ヒドロゲル組成物を形成すること、の工程を備える方法。
2. 製薬的活性剤が、上記懸濁物が上記水性媒体と混合される前に、水性媒体中に溶解され、または水混和性有機溶媒中に懸濁または溶解される請求項1記載の方法。
3. 製薬的活性剤が、ポリサッカリドがその中に懸濁される前の水混和性有機溶媒中に懸濁または溶解される請求項2記載の方法。
4. 製薬的活性剤が、15-50℃、25-40℃、または35-40℃の温度で水性媒体中に溶解される請求項2記載の方法。
5. ポリサッカリド懸濁物が、水性媒体との混合の直前に、4-30℃、好ましくは15-25℃又は4-15℃、好ましくは10-15℃の温度とされる請求項1から4のいずれか1項記載の方法。
6. 製薬的活性剤が、ニトロイミダゾール薬である請求項1から5のいずれか1項記載の方法。
7. ニトロイミダゾール薬が、メトロニダゾル又はチニダゾール、好ましくはメトロニダゾルである請求項6記載の方法。
8. 組成物が、生理学的に許容されるpHを有するように緩衝化される請求項1から7のいずれか1項記載の方法。
9. 緩衝剤を、好ましくは懸濁したポリサッカリドが上記媒体と混合される前に、水性媒体中に含ませる請求項8記載の方法。
10. 緩衝剤が、酢酸／酢酸塩、塩酸／クエン酸塩、クエン酸／クエン酸塩、シトロールリン酸塩、リン酸塩、又はリン酸緩衝化塩溶液、緩衝系を含む請求項8又は9記載の方法。
11. 緩衝系が、クエン酸とクエン酸塩、好ましくはクエン酸ナトリウムを含む請求項10記載の方法。
12. 組成物が、4.5-6.5の範囲内の、好ましくは5-6の範囲内の、より好ましくは約5.5のpHを有する請求項1から11のいずれか1項記載の方法。
13. ポリサッカリドが、非イオン性セルロースエステル、エーテル、ヒドロキシエーテル、又はヒドロキシエステル、又は非イオン性デンプン誘導体である請求項1から12のいずれか1項記載の方法。
14. ポリサッカリドが、ヒドロキシアルキルセルロースである請求項1から13のいずれか1項記載の方法。
15. ポリサッカリドが、メチル、エチル又はプロピルセルロースエステル、エーテル、ヒドロキシエーテル、又はヒドロキシエステルである請求項13記載の方法。
16. ヒドロキシアルキルセルロースが、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はヒドロキシプロピルセルロース、好ましくはヒドロキシエチルセルロースである請求項14記載の組成物。
17. ポリサッカリドが、水混和性有機溶媒中に不溶である又は実質的に不溶である請求項1から16のいずれか1項記載の方法。
18. 水混和性有機溶媒が、水混和性アルキレングリコールである請求項1から17のいずれか1項記載の方法。
19. 水混和性アルキレングリコールが、グリセロール、ジプロピレングリコール、プロピレングリコール、ブチレングリコール、ペンチレングリコール又はヘキシレングリコール、好ましくはプロピレングリコールである請求項18記載の方法。
20. 請求項1から19のいずれか1項記載の方法によって調製され又は調製可能な、乾燥又は炎症化した皮膚を含む皮膚状態の局部治療において使用するための、粘性ヒドロゲル組成物。
21. 抗菌活性ニトロイミダゾール薬、水混和性アルキレングリコール、ヒドロキシアルキルセルロースゲル化剤及び水を含み、生理学的に許容されるpHを有するように緩衝化された、乾燥又は炎症化した皮膚を含む皮膚状態の局部治療において使用するための、粘性ヒドロゲル組成物。
22. いずれかの補足的な製薬活性剤を欠いている請求項21記載の組成物。
23. 抗菌活性ニトロイミダゾール薬が、唯一の製薬的活性剤である請求項22記載の組成物。
24. ヒドロキシアルキルセルロースゲル化剤が、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル又はヒドロキシプロピルセルロース、好ましくはヒドロキシエチルセルロースである請求項20から23のいずれか1項記載の組成物。
25. 抗菌活性ニトロイミダゾールが、メトロニダゾル又はチニダゾール、好ましくはメトロニダゾルである請求項20から24のいずれか1項記載の組成物。
26. 酢酸／酢酸塩、塩酸／クエン酸塩、クエン酸／クエン酸塩、シトロールリン酸塩、リン酸塩、又はリン酸緩衝化塩溶液、緩衝系をさらに備えた請求項20から25のいずれか1項記載の組成物。

27. 緩衝化剤として、クエン酸とクエン酸塩、好ましくはクエン酸ナトリウムを含んだ請求項26記載の組成物。
28. 10, 000、好ましくは50, 000から200, 000cpsの範囲内の粘度を有する請求項20から27のいずれか1項記載の組成物。
29. 4. 5-6. 5の範囲内の、好ましくは5-6の範囲内の、より好ましくは約5. 5のpHを有する請求項20から28のいずれか1項記載の組成物。
30. 皮膚状態が、しゅさ、湿疹であり、又は抗菌活性ニトロイミダゾール、好ましくはメロニダゾルに応答する感染を含む請求項20から29のいずれか1項記載の組成物。
31. ヒドロキシアルキルセルロースゲル化剤が、水混和性アルキレングリコール中に不溶又は実質的に不溶である請求項20から30のいずれか1項記載の組成物。
32. 水混和性アルキレングリコールが、グリセロール、ジプロピレングリコール、プロピレングリコール、ブチレングリコール、ペンチレングリコール又はヘキシレングリコール、好ましくはプロピレングリコールである請求項20から31のいずれか1項記載の組成物。
33. 組成物が、請求項21から32のいずれか1項に従うものである、請求項1から18のいずれか1項記載の方法。
34. 乾燥又は炎症化した皮膚を含んだ皮膚状態、好ましくは、しゅさ、湿疹、又は抗菌活性ニトロイミダゾール、好ましくはメロニダゾルに応答する感染を含む状態の治療のための医薬品を調製するための、請求項20から32のいずれか1項記載の組成物の使用。
35. 乾燥又は炎症化した皮膚を含んだ皮膚状態、好ましくは、しゅさ、湿疹、又は抗菌活性ニトロイミダゾール、好ましくはメロニダゾルに応答する感染を含む状態の治療において使用するための請求項20から32のいずれか1項記載の医薬品の調製のためのニトロイミダゾール薬の使用。
36. 乾燥又は炎症化した皮膚を含んだ皮膚状態、好ましくは、しゅさ、湿疹、又は抗菌活性ニトロイミダゾール、好ましくはメロニダゾルに応答する感染を含む状態を治療する方法であり、請求項20から32のいずれか1項記載の組成物を局部的に適用することを備える方法。