

請求の範囲

- [請求項1] ヒトの身体表面に外用塗布するための医薬製剤であって、
- (a) ソフピロニウム臭化物と、
 - (b) 1又は複数の水溶性高分子と、
 - (c) エタノールと、
- を含有し、pHが5.2以下であり、均一に分散された、非水製剤又は含水率が5 w/w%以下の低含水製剤であり、
- 前記pHは、調液してから6か月間で選択される1又は複数のいずれかの時点で測定され、前記pHは、室温で保存された前記製剤のpHを測定することによって決定され、かつ、前記pHは、非水溶媒用pH電極を前記製剤に5分間浸した後の値である、製剤。
- [請求項2] ソフピロニウム臭化物の含有量が、全製剤量に対して、1w/w%から20w/w%である、請求項1に記載の製剤。
- [請求項3] pHが2.5から5.2の範囲内である、請求項1又は請求項2に記載の製剤。
- [請求項4] 均一に溶解された製剤である、請求項1又は請求項2に記載の製剤。
- [請求項5] 水溶性高分子が、水溶性ビニルポリマー系高分子、又は水溶性セルロース系高分子である、請求項1から請求項4のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項6] 水溶性高分子が、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシエチルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキシビニルポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニル系共重合体、ポリビニルピロリドン、及びコポリドンからなる群より選択される、請求項1から請求項4のいずれか一つの製剤。
- [請求項7] 水溶性高分子が、ヒドロキシプロピルセルロース、又はカルボキシビニルポリマーである、請求項1から請求項4のいずれか一つに記載の製剤。

- [請求項8] 水溶性高分子の含有量が、全製剤量に対して、0.01w/w%から5.0w/w%である、請求項1から請求項7のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項9] エタノールの含有量が、全製剤量に対して、50w/w%以上から99w/w%未満である請求項1から請求項8のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項10] さらに、pH調整剤を含有する、請求項1から請求項9のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項11] pH調整剤が、酒石酸、酢酸、及びクエン酸からなる群より選択される酸、又はその塩である、請求項10に記載の製剤。
- [請求項12] pH調整剤の含有量が、全製剤量に対して、0.015w/w%から5w/w%である、請求項10又は請求項11に記載の製剤。
- [請求項13] さらに、不揮発性オイルを含有する、請求項1から請求項12のいずれか一つに記載の製剤（但し、ジメチコノールブレンド20を含む製剤を除く）。
- [請求項14] 不揮発性オイルが、不揮発性エステル、不揮発性エーテル、不揮発性シリコーン、及び不揮発性アルコールからなる群から選択される、請求項13に記載の製剤。
- [請求項15] 不揮発性オイルが、
 R_1COOR_2 で表され、 R_1 及び R_2 の一方が、置換されていてもよい C_4 - C_{40} 直鎖アルキル基、又は置換されていてもよい C_4 - C_{40} 分岐鎖アルキル基であり、かつ、
 R_1 及び R_2 の他方が、置換されていてもよい C_1 - C_{40} アルキル基である、モノエステル、ジエステル、及びトリエステルからなる群より選択される不揮発性エステルである、請求項13に記載の製剤。
- [請求項16] 不揮発性オイルが、ミリスチン酸エチル、ミリスチン酸2-オクチルドデシル、ステアリン酸ブチル、ステアリン酸イソセチル、ステアリン酸2-オクチルドデシル、ラウリン酸ヘキシル、ラウリン酸2-ヘキシルデシル、パルミチン酸2-エチルヘキシル、パルミチン酸2-オクチルデシル、オクタン酸セテアリル、イソノナン酸イソノニル、ネオペンタ

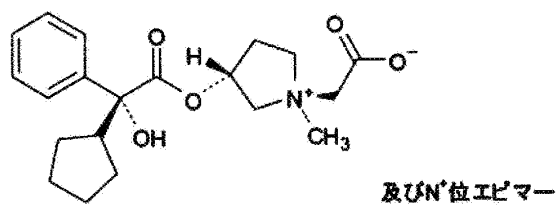
ン酸オクチルドデシル、エルカ酸2-オクチルドデシル、安息香酸2-オクチルドデシル、デカン酸エステル、リシノール酸エステル、ミリスチン酸イソプロピル、アジピン酸ジイソプロピル、中鎖脂肪酸トリグリセリド、パルミチン酸イソプロピル、エチルヘキサン酸アルキル(C14-C18)、ミリスチン酸ミリスチル、オレイン酸エチル、オレイン酸オレイル、パルミチン酸エチルヘキシル、パルミチン酸セチル、ミリスチン酸2-ヘキシルデシル、パルミチン酸2-ヘキシルデシル、ミリスチン酸PPG-3ベンジルエーテル、イソノナン酸イソトリデシル、トリメリト酸トリエチルヘキシル、安息香酸アルキル(C12-C15)、コハク酸ジエトキシエチル、ジカプリン酸プロピレングリコール、ジカプリル酸プロピレングリコール、トリ(カプリル・カプリン酸)グリセリル、トリエチルヘキサノイン、トリイソステアリン、イソステアリン酸イソプロピル、イソステアリン酸イソステアリル、トリイソステアリン酸ポリグリセリル-2、コハク酸ジエチルヘキシル、プロピオン酸PPG-2ミリスチル、テトライソステアリン酸ペンタエリスリチル、セバシン酸ジエチル、エチルヘキサン酸PPG-3ベンジルエーテル、トリベヘン酸グリセリル、2-エチルヘキサン酸セチル、リンゴ酸ジイソステアリル、ステアリン酸2-エチルヘキシル、クエン酸トリエチルヘキシル、及び乳酸エチル等の乳酸アルキルからなる群より選択される不揮発性脂肪酸エステルである、請求項13に記載の製剤。

[請求項17] 不揮発性オイルが、ミリスチン酸イソプロピル、アジピン酸ジイソプロピル、及び中鎖脂肪酸トリグリセリドからなる群より選択される不揮発性脂肪酸エステルである、請求項13に記載の製剤。

[請求項18] 不揮発性オイルが、医療等級のシリコーン油、メチルフェニルシリコーン、メチルヒドロジェンシリコーン、デカメチルペンタシクロシロキサン、オクタメチルテトラシクロシロキサン、シクロメチコン5-NF、PEG-12ジメチコン、ジメチコン20cSt、ジメチコン100cSt、ジメチコン350cSt、ジメチコン500cSt、ジメチコン1000cSt、及びジメチ

- コン12500cStからなる群より選択される不揮発性シリコンである、請求項 1 3 に記載の製剤。
- [請求項19] 不揮発性オイルが、シクロメチコン5-NF、PEG-12ジメチコン、ジメチコン20cSt、及びジメチコン350cStからなる群より選択される不揮発性シリコンである、請求項 1 3 に記載の製剤。
- [請求項20] 不揮発性オイルの含有量が、全製剤量に対して、0.5w/w%から10w/w%である、請求項 1 3 から請求項 1 9 のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項21] さらに、多価アルコールを含有する、請求項 1 から請求項 2 0 のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項22] 多価アルコールが、ヘキシレングリコール、プロピレングリコール、エチレングリコール、グリセロール、及びブチレングリコールからなる群より選択される、請求項 2 1 に記載の製剤。
- [請求項23] 多価アルコールの含有量が、全製剤量に対して、1.0w/w%から30w/w%である、請求項 2 1 又は請求項 2 2 に記載の製剤。
- [請求項24] 25℃における粘度が10 mPa・sから2000 mPa・sである、請求項 1 から請求項 2 3 のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項25] 調液してから室温で36か月保存した後、又は調液してから40℃で3か月保存した後の、25℃における粘度が10 mPa・sから1000 mPa・sである、請求項 1 から請求項 2 4 のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項26] 多汗症、過活動膀胱、慢性閉塞性肺疾患、心臓疾患、流涎症、眼疾患、及び気管支喘息からなる群より選択される疾患を、処置、治療、又は予防するための、請求項 1 から請求項 2 5 のいずれか一つに記載の製剤。
- [請求項27] 調液してから室温で36か月保存した後、又は調液してから40℃で3か月保存した後の、下記式 (II) :

[化1]



で示される化合物 (II) の含有量が、ソフピロニウム臭化物の含有量
に対して、1.5w/w%以下であり、ソフピロニウム臭化物の純度が90w/w
%以上である、請求項 1 から請求項 26 のいずれか一つに記載の製剤

。