

【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18年7月6日(2006.7.6)

【公表番号】特表2005-533106(P2005-533106A)

【公表日】平成17年11月4日(2005.11.4)

【年通号数】公開・登録公報2005-043

【出願番号】特願2004-521510(P2004-521510)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 27/06

【手続補正書】

【提出日】平成18年5月19日(2006.5.19)

【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】

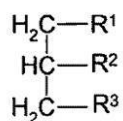
【特許請求の範囲】

【請求項1】

生体侵食性薬物送達フィルム組成物であって、該組成物は、以下：

(i) 眼科学的に受容可能な薬物、(ii) 水溶性フィルム形成ポリマーおよび(iii) 150～4000の分子量を有する脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸エステルを含み、  
ここで、該脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸エステルは、式

【化1】



(I)

を有し、

ここで、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$  および  $\text{R}^3$  は、独立して、 $-\text{H}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{C}_n\text{H}_{2n+1-2m}$ 、 $-\text{OOC C}_n\text{H}_{2n+1-2m}$ 、 $-\text{COOC}_n\text{H}_{2n+1-2m}$ 、 $-\text{COO}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{C}_n\text{H}_{2n+1-2m}\text{COO}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{OC}_n\text{H}_{2n+1-2m}\text{COO}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_2$

$\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{OOCCH}_n\text{H}_{2n+1-2m}\text{COOCH}_{n'}\text{H}_{2n'+1-2m'}$  であり；  
 $n$  および  $n'$  は、独立して、 $0 \sim 50$  であり；そして  
 $m$  および  $m'$  は、独立して、 $0 \sim 10$  である、フィルム組成物。

【請求項 2】

前記水溶性フィルム形成ポリマーが、以下：ヒドロキシプロピルセルロース；ポリビニルアルコール；ポリアクリル酸；ヒドロキシプロピルメチルセルロース；カルボキシメチルセルロース；およびヒドロキシエチルセルロースからなる群から選択される、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 3】

前記水溶性フィルム形成ポリマーが、以下：ヒドロキシプロピルセルロース；ポリビニルアルコール；およびカルボキシメチルセルロースからなる群から選択される、請求項 2 に記載のフィルム組成物。

【請求項 4】

前記水溶性フィルム形成ポリマーが、ヒドロキシプロピルセルロースである、請求項 3 に記載のフィルム組成物。

【請求項 5】

前記フィルム組成物が、 $25 \sim 99.5\%$  ( $w/w$ ) のフィルム形成ポリマーを含む、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 6】

前記フィルム組成物が、(i) 眼科学的に受容可能な薬物、(ii) 水溶性フィルム形成ポリマーおよび (iii) 脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸エステルから構成される、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 7】

$R^1$ 、 $R^2$  および  $R^3$  が、独立して、 $-\text{H}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{CH}_n\text{H}_{2n+1-2m}$  または  $-\text{OOCCH}_n\text{H}_{2n+1-2m}$  であり；  
 $n$  および  $n'$  が、独立して、 $0 \sim 25$  であり；そして  
 $m$  および  $m'$  が、独立して、 $0 \sim 3$  である、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 8】

前記組成物が、46 以下の融点を有する式 (I) の単独の脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸グリセリドの混合物を含む、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 9】

前記組成物が、42 以下の融点を有する式 (I) の単独の脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸グリセリドの混合物を含む、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 10】

前記フィルム組成物が、前記水溶性フィルム形成ポリマーの  $0.5 \sim 25$  重量%と等しい量の脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸エステルを含む、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 11】

前記フィルム組成物が、前記水溶性フィルム形成ポリマーの  $1 \sim 10$  重量%と等しい量の脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸エステルを含む、請求項 10 に記載のフィルム組成物。

【請求項 12】

前記フィルム組成物が、前記水溶性フィルム形成ポリマーの  $3 \sim 5$  重量%と等しい量の脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸エステルを含む、請求項 11 に記載のフィルム組成物。

【請求項 13】

前記フィルム組成物が、 $0.0001 \sim 25\%$  ( $w/w$ ) の眼科学的に受容可能な薬物を含む、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 14】

前記フィルム組成物が、 $0.5 \sim 1\%$  ( $w/w$ ) の眼科学的に受容可能な薬物を含み、該眼科学的に受容可能な薬物がパクリタキセルである、請求項 13 に記載のフィルム組成物。

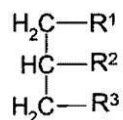
【請求項 15】

前記フィルム組成物が、必要に応じて、以下：界面活性剤、キレート剤および抗酸化剤からなる群から選択される賦形剤を含む、請求項 1 に記載のフィルム組成物。

【請求項 16】

眼の疾患を処置するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、(i) 眼科学的に受容可能な薬物、(ii) 水溶性フィルム形成ポリマーおよび(iii) 150～4000の分子量を有する脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸エステルを含み、ここで該脂肪酸グリセリドまたは脂肪酸エステルは、式

【化 2】



(I)

を有し、

ここで、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$  および  $\text{R}^3$  は、独立して、 $-\text{H}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{C}_n\text{H}_{2n+1-2m}$ 、 $-\text{OOC C}_n\text{H}_{2n+1-2m}$ 、 $-\text{COOC}_n\text{H}_{2n+1-2m}$ 、 $-\text{COO}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{C}_n\text{H}_{2n+1-2m}\text{COO}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{OOC C}_n\text{H}_{2n+1-2m}\text{COOC}_n\text{H}_{2n'+1-2m'}$  であり；

$n$  および  $n'$  は、独立して、0～50であり；そして

$m$  および  $m'$  は、独立して、0～10であり、

該眼へ挿入するための生体侵食性薬物送達フィルム組成物として処方されている、薬学的組成物。

【請求項 17】

前記フィルム組成物が、結膜下インプラントまたはトノン下腔インプラントとして眼に挿入される、請求項 16 に記載の薬学的組成物。

【請求項 18】

前記眼科学的に受容可能な薬物が、抗増殖性薬物であり、そして前記薬物送達フィルム組成物が、緑内障手術と共に使用される、請求項 16 に記載の薬学的組成物。

【請求項 19】

前記薬物送達フィルム組成物が、非穿孔性緑内障手術と共に使用される、請求項 18 に記載の薬学的組成物。