

【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3区分
 【発行日】令和3年7月26日(2021.7.26)

【公開番号】特開2021-73324(P2021-73324A)
 【公開日】令和3年5月13日(2021.5.13)
 【年通号数】公開・登録公報2021-022
 【出願番号】特願2020-203627(P2020-203627)
 【国際特許分類】

C 0 9 J 201/06 (2006.01)
 C 0 9 J 133/14 (2006.01)
 C 0 9 J 133/26 (2006.01)
 C 0 9 J 7/38 (2018.01)
 C 0 8 F 20/20 (2006.01)
 A 6 1 K 9/70 (2006.01)
 A 6 1 K 47/32 (2006.01)
 A 6 1 L 15/00 (2006.01)
 B 3 2 B 27/00 (2006.01)
 B 3 2 B 7/06 (2019.01)

【 F I 】

C 0 9 J 201/06
 C 0 9 J 133/14
 C 0 9 J 133/26
 C 0 9 J 7/38
 C 0 8 F 20/20
 A 6 1 K 9/70 4 0 1
 A 6 1 K 47/32
 A 6 1 L 15/00
 B 3 2 B 27/00 L
 B 3 2 B 27/00 M
 B 3 2 B 7/06

【手続補正書】

【提出日】令和3年5月31日(2021.5.31)

【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】

3部構造を有する感圧粘着剤ポリマー(P S A)を含む経皮薬物送達組成物であって、皮膚模倣用極性基を有する皮膚模倣用モノマーを含むモノマーから形成された皮膚模倣用部分であって、皮膚模倣用モノマーがグルコシル基を有するモノマー、2個以上のヒドロキシル基を有するモノマー、およびそれらの任意の2個以上の組合せからなる群から選択される、皮膚模倣用部分；

弱親水性モノマーを含むモノマーから形成された弱親水性部分であって、弱親水性モノマーが、メトキシエチルアクリレート(M E A)、ポリエチレングリコールモノメタクリレート(P E G M A)、およびそれらの組合せからなる群から選択される、弱親水性部分；および、

疎水性モノマーを含むモノマーから形成された疎水性部分を含み、ここでP S Aが親水性ヒドロキシエチルメタクリレート（H E M A）、ヒドロキシエチルアクリレート（H E A）、アクリル酸（A A）、メチルアクリル酸（M A A）、およびそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択されるさらなるモノマーから重合され、かつ、P S Aの皮膚模倣用部分は組成物の皮膚と接触する領域に所在し、弱親水性部分は皮膚模倣用部分と疎水性部分の間に所在する、経皮薬物送達組成物。

【請求項2】

皮膚模倣用モノマーがグルコシル基を有する、請求項1に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項3】

皮膚模倣用モノマーがグルコシルオキシエチルメタクリレート（G O E M A）である、請求項2に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項4】

皮膚模倣用モノマーが2個以上のヒドロキシル基を有する、請求項1に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項5】

皮膚模倣用モノマーがn - （ヒドロキシメチル）基を有し、nが2から6の整数である、請求項4に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項6】

皮膚模倣用モノマーがN - [トリス（ヒドロキシルメチル）メチル] アクリルアミド（T R I S - O H）である、請求項5に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項7】

皮膚模倣用モノマーが、G O E M A、T R I S - O H、2, 3 - ジヒドロキシプロピルアクリレート、グリセロールモノメタクリレート、1, 1, 1 - トリメチロールプロパンモノア릴エーテル、ペンタエリトリールモノアクリレート、ペンタエリトリールモノメタクリレート、ソルビトールモノアクリレート、ソルビトールモノメタクリレート、および1個または複数のカテコール基を含有するアクリレート、ならびにそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択される、請求項1に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項8】

疎水性モノマーが、酢酸ビニル（V A）、メチルメタクリレート（M M A）、メチルアクリレート（M A）、n - ブチルアクリレート（n - B A）、2 - エチルヘキシルアクリレート（2 - E H A）、トリス（トリメチルシリルオキシ）シリル）プロピルメタクリレート（T R I S - S i）、およびそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択される、請求項1に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項9】

(i) G O E M A、T R I S - O H、2, 3 - ジヒドロキシプロピルアクリレート、グリセロールモノメタクリレート、1, 1, 1 - トリメチロールプロパンモノア릴エーテル、ペンタエリトリールモノアクリレート、ペンタエリトリールモノメタクリレート、ソルビトールモノアクリレート、ソルビトールモノメタクリレート、および1個または複数のカテコール基を含有するアクリレート、ならびにそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択される皮膚模倣用モノマー；

(i i) メトキシエチルアクリレート（M E A）およびポリエチレングリコールモノメタクリレート（P E G M A）、ならびにそれらの組合せからなる群から選択される弱親水性モノマー；

(i i i) 酢酸ビニル（V A）、メチルメタクリレート（M M A）、メチルアクリレート（M A）、n - ブチルアクリレート（n - B A）、2 - エチルヘキシルアクリレート（2 - E H A）、トリス（トリメチルシリルオキシ）シリル）プロピルメタクリレート（T R I S - S i）、およびそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択される疎水性モノマー、を含むモノマーから重合された、請求項1に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項10】

P S Aが、薬物含有粘着剤マトリックス中に含まれる、請求項1に記載の経皮薬物送達

組成物。

【請求項 1 1】

P S A が、薬物不含層中に含まれる、請求項 1 に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項 1 2】

裏打ち層をさらに含む、請求項 1 に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項 1 3】

剥離ライナーをさらに含む、請求項 1 2 に記載の経皮薬物送達組成物。

【請求項 1 4】

請求項 1 に記載の経皮薬物送達組成物を含む包帯。

【請求項 1 5】

請求項 1 に記載の経皮薬物送達組成物を含む、皮膚に粘着されるデバイス。

【請求項 1 6】

皮膚模倣用極性基を有する皮膚模倣用モノマーを含むモノマーを重合させることを含む、請求項 1 に記載の経皮薬物送達組成物を作製する方法であり、皮膚模倣用モノマーが、グルコシル基を有するモノマー、2 個以上のヒドロキシル基を有するモノマー、およびそれらの任意の 2 種以上の組合せからなる群から選択される、経皮薬物送達組成物を作製する方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 3 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 5】

【表 5】

表5 コポリマーA、B、およびCの粘着性

コポリマー	サム(Thumb)粘着性 (1~10)	プローブ粘着性 (g/0.5cm ²)	180° RL引き剥がし (g/0.5インチ)	90° SS引き剥がし (g/0.5インチ)	剪断(分、0.75インチ、250g)
A	5	50.5	4.5	Del*	334
B	3	0.5	4.0	Del*	>5,000
C	8	186.7	20.4	113.2	111

Del*:裏打ちから剥がれた。

【表 6】

表6 コポリマーA、B、およびCの粘弾性的性質。

ω (ラジアン/秒)	コポリマーA				コポリマーB				コポリマーC			
	Eta* (P)	G' (ダイン/c m ²)	G'' (ダイン/c m ²)	Tan δ	Eta* (P)	G' (ダイン/c m ²)	G'' (ダイン/c m ²)	Tan δ	Eta* (P)	G' (ダイン/c m ²)	G'' (ダイン/c m ²)	Tan δ
0.01	1.1e ⁶	5.1e ³	9.6e ³	1.9	5.9e ⁶	4.5e ⁴	3.8e ⁴	0.8	7.3e ⁵	4.1e ³	6.0e ³	1.5
0.1	4.6e ⁵	2.8e ⁴	3.6e ⁴	1.3	1.8e ⁶	1.3e ⁵	1.3e ⁵	1.0	2.7e ⁵	1.9e ⁴	1.9e ⁴	1.0
1	1.7e ⁵	1.0e ⁵	1.3e ⁵	1.3	6.4e ⁵	3.9e ⁵	5.1e ⁵	1.3	8.1e ⁴	5.8e ⁴	5.7e ⁴	1.0
10	6.6e ⁴	3.6e ⁵	5.6e ⁵	1.6	2.7e ⁵	1.4e ⁶	2.3e ⁶	1.6	2.6e ⁴	1.8e ⁵	1.9e ⁵	1.1
100	3.0e ⁴	1.4e ⁶	2.7e ⁶	1.9	1.3e ⁵	6.2e ⁶	1.1e ⁷	1.8	9.2e ³	5.7e ⁵	7.2e ⁵	1.3

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕皮膚模倣用極性基を有する皮膚模倣用モノマーを含むモノマーから重合された感圧粘着剤ポリマー（PSA）であって、皮膚模倣用モノマーがグルコシル基を有するモノマー、2個以上のヒドロキシル基を有するモノマー、およびそれらの任意の2個以上の組合せからなる群から選択される、感圧粘着剤ポリマー（PSA）。

〔2〕皮膚模倣用モノマーがグルコシル基を有する、前記〔1〕に記載のPSA。

〔3〕皮膚模倣用モノマーがグルコシルオキシエチルメタクリレート（GOEMA）である、前記〔2〕に記載のPSA。

〔4〕皮膚模倣用モノマーが2個以上のヒドロキシル基を有する、前記〔1〕に記載のPSA。

〔5〕皮膚模倣用モノマーがn-（ヒドロキシメチル）基を有し、nが2から6の整数である、前記〔4〕に記載のPSA。

〔6〕皮膚模倣用モノマーがN-〔トリス（ヒドロキシルメチル）メチル〕アクリルアミド（TRIS-OH）である、前記〔5〕に記載のPSA。

〔7〕皮膚模倣用モノマーが、GOEMA、TRIS-OH、2,3-ジヒドロキシプロピルアクリレート、グリセロールモノメタクリレート、1,1,1-トリメチロールプロパンモノア릴エーテル、ペンタエリトリールモノアクリレート、ペンタエリトリールモノメタクリレート、ソルビトールモノアクリレート、ソルビトールモノメタクリレート、および1個または複数のカテコール基を含有するアクリレート、ならびにそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択される、前記〔1〕に記載のPSA。

〔8〕皮膚模倣用極性基を有する皮膚模倣用モノマー、弱親水性モノマー、および疎水性モノマーを含むモノマーから重合された、前記〔1〕に記載のPSA。

〔9〕皮膚模倣用モノマーを含むモノマーから形成された皮膚模倣用部分、親水性モノマーを含むモノマーから形成された弱親水性部分、および疎水性モノマーを含むモノマーから形成された疎水性部分を含む3部構造を有する、前記〔8〕に記載のPSA。

〔10〕皮膚模倣用モノマーが、GOEMA、TRIS-OH、2,3-ジヒドロキシプロピルアクリレート、グリセロールモノメタクリレート、1,1,1-トリメチロールプロパンモノア릴エーテル、ペンタエリトリールモノアクリレート、ペンタエリトリールモノメタクリレート、ソルビトールモノアクリレート、ソルビトールモノメタクリレート、および1個または複数のカテコール基を含有するアクリレート、ならびにそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択される、前記〔8〕に記載のPSA。

〔11〕弱親水性モノマーが、メトキシエチルアクリレート（MEA）、ポリエチレングリコールモノメタクリレート（PEGMA）、およびそれらの組合せからなる群から選択される、前記〔8〕に記載のPSA。

〔12〕疎水性モノマーが、酢酸ビニル（VA）、メチルメタクリレート（MMA）、メチルアクリレート（MA）、n-ブチルアクリレート（n-BA）、2-エチルヘキシルアクリレート（2-EHA）、トリス（トリメチルシリルオキシ）シリル）プロピルメタクリレート（TRIS-Si）、およびそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択される、前記〔8〕に記載のPSA。

〔13〕親水性ヒドロキシエチルメタクリレート（HEMA）、ヒドロキシエチルアクリレート（HEA）、アクリル酸（AA）、メチルアクリル酸（MAA）、およびそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択されるさらなるモノマーから重合された、前記〔8〕に記載のPSA。

〔14〕(i) GOEMA、TRIS-OH、2,3-ジヒドロキシプロピルアクリレート、グリセロールモノメタクリレート、1,1,1-トリメチロールプロパンモノア릴エーテル、ペンタエリトリールモノアクリレート、ペンタエリトリールモノメタクリレート、ソルビトールモノアクリレート、ソルビトールモノメタクリレート、および1個または複数のカテコール基を含有するアクリレート、およびそれらの任意の2種以上の組合せからなる群から選択される皮膚模倣用モノマー；

(ii) メトキシエチルアクリレート（MEA）およびポリエチレングリコールモノメ

タクリレート (P E G M A)、ならびにそれらの組合せからなる群から選択される弱親水性モノマー；

(i i i) 酢酸ビニル (V A)、メチルメタクリレート (M M A)、メチルアクリレート (M A)、n - ブチルアクリレート (n - B A)、2 - エチルヘキシルアクリレート (2 - E H A)、トリス (トリメチルシリルオキシ) シリル) プロピルメタクリレート (T R I S - S i)、およびそれらの任意の 2 種以上の組合せからなる群から選択される疎水性モノマー

を含み、

(i v) 親水性ヒドロキシエチルメタクリレート (H E M A)、ヒドロキシエチルアクリレート (H E A)、アクリル酸 (A A)、メチルアクリル酸 (M A A)、およびそれらの任意の 2 種以上の組合せからなる群から選択されるさらなるモノマー

を含んでもよい

モノマーから重合された、前記〔 1 〕に記載の P S A。

〔 1 5 〕前記〔 1 〕に記載の P S A を含む組成物。

〔 1 6 〕前記〔 1 〕に記載の P S A を含む経皮薬物送達組成物。

〔 1 7 〕前記〔 8 〕に記載の P S A を含む経皮薬物送達組成物。

〔 1 8 〕 P S A が、薬物含有粘着剤マトリックス中に含まれる、前記〔 1 6 〕に記載の経皮薬物送達組成物。

〔 1 9 〕 P S A が、薬物不含層中に含まれる、前記〔 1 6 〕に記載の経皮薬物送達組成物。

〔 2 0 〕裏打ち層をさらに含む、前記〔 1 6 〕に記載の経皮薬物送達組成物。

〔 2 1 〕剥離ライナーをさらに含む、前記〔 2 0 〕に記載の経皮薬物送達組成物。

〔 2 2 〕前記〔 1 〕に記載の P S A を含む包帯。

〔 2 3 〕前記〔 1 〕に記載の P S A を含む、皮膚に粘着されるデバイス。

〔 2 4 〕皮膚模倣用極性基を有する皮膚模倣用モノマーを含むモノマーを重合させることを含む、前記〔 1 〕に記載の P S A を作製する方法であり、皮膚模倣用モノマーが、グルコシル基を有するモノマー、2 個以上のヒドロキシル基を有するモノマー、およびそれらの任意の 2 種以上の組合せからなる群から選択される、P S A を作製する方法。

〔 2 5 〕皮膚模倣用極性基を有する皮膚模倣用モノマー、親水性モノマー、および疎水性モノマーを含むモノマーを重合させることを含む、前記〔 8 〕に記載の P S A を作製する方法。

〔 2 6 〕前記〔 1 〕に記載の P S A を含む組成物を皮膚に適用することを含む、組成物を皮膚に粘着させる方法。

〔 2 7 〕前記〔 8 〕に記載の P S A を含む組成物を皮膚に適用することを含む、組成物を皮膚に粘着させる方法。

〔 2 8 〕組成物が水に曝されたときに皮膚に粘着されたままである、前記〔 2 7 〕に記載の方法。