

【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 27 日 (2006.7.27)

【公表番号】特表 2005-530842 (P2005-530842A)

【公表日】平成 17 年 10 月 13 日 (2005.10.13)

【年通号数】公開・登録公報 2005-040

【出願番号】特願 2004-515837 (P2004-515837)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 31/58 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 31/58

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 6 月 7 日 (2006.6.7)

【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】

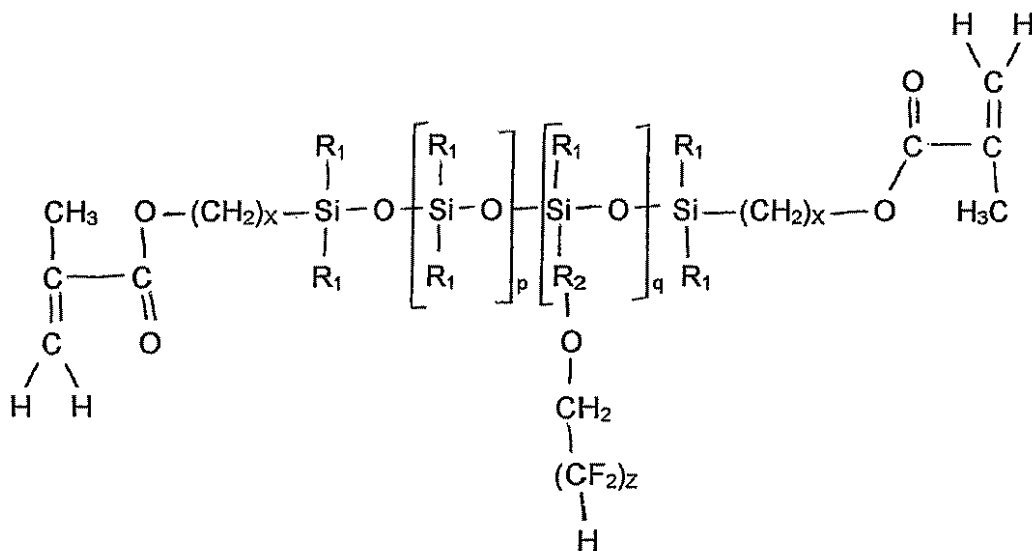
【請求項 1】

マトリックス制御拡散薬物送達システムであって、治療有効量の少なくとも 1 つの薬学的に活性な薬剤および必要に応じて 1 つ以上のモノマーと重合したフッ化側鎖シロキサンコポリマーを含む、システム。

【請求項 2】

マトリックス制御拡散薬物送達システムであって、以下：

【化 1】



によって表される、フッ化側鎖シロキサンコポリマーを含み、ここで、 R_1 基は、 C_{1-7} アルキルおよび C_{6-10} アリールからなる群より選択され、同じであっても異なってもよく； R_2 基は、 C_{1-7} アルキレンであり； x は、2-6 未満の自然数であり； p

および q は、同じであっても異なってもよい、100未満の自然数であり、そして z は、11未満の自然数であり、該コポリマーは、治療有効量の少なくとも1つの薬学的に活性な薬剤および必要に応じて1つ以上のモノマーと重合している、システム。

【請求項3】

前記少なくとも1つの薬学的に活性な薬剤が、抗緑内障剤、抗白内障剤、抗糖尿病性網膜症剤、チオール架橋剤、抗癌剤、免疫モジュレーター、抗凝固剤、抗組織傷害剤、抗炎症剤、抗線維剤、非ステロイド性抗炎症剤、抗生物質、抗病原体剤、ピペラジン誘導体、毛様体筋麻痺剤および散瞳剤からなる群より選択される、請求項1または2に記載のマトリックス制御拡散薬物送達システム。

【請求項4】

前記少なくとも1つの薬学的に活性な薬剤が、抗コリン作用性薬剤、抗凝血剤、抗フィブリン溶解剤、抗ヒスタミン剤、抗マラリア剤、抗毒素、キレート剤、ホルモン、免疫抑制剤、血栓溶解剤、ビタミン、塩、減感作剤、プロスタグランジン、アミノ酸、代謝産物および抗アレルギー性物質からなる群より選択される、請求項1または2に記載のマトリックス制御拡散薬物送達システム。

【請求項5】

前記少なくとも1つの薬学的に活性な薬剤が、ヒドロコルチゾン、ゲンタマイシン、5-フルオロウラシル、ソルビニル、インターロイキン-2、ファークエン-a、チオロアチオプロニン、ベンダザック、アセチルサルチル酸、フルオシノロンアセトニド、トリフルオロチミジン、インターフェロン、免疫モジュレーターおよび増殖因子からなる群より選択される、請求項1または2に記載のマトリックス制御拡散薬物送達システム。

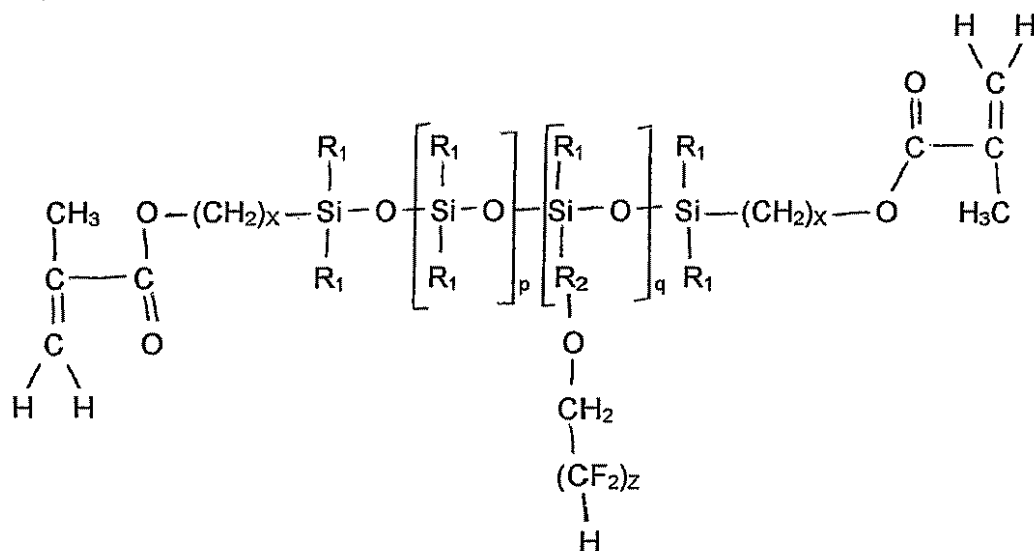
【請求項6】

前記1つ以上モノマーが、メチルメタクリレート、N,N-ジメチルアクリルアミド、アクリルアミド、N-メチルアクリルアミド、2-ヒドロキシエチルメタクリレート、ヒドロキシエトキシエチルメタクリレート、ヒドロキシジエトキシエチルメタクリレート、メトキシエチルメタクリレート、メトキシエトキシエチルメタクリレート、メトキシジエトキシエチルメタクリレート、ポリ(エチレングリコール)メタクリレート、メトキシ-ポリ(エチレングリコール)メタクリレート、メタクリル酸、ナトリウムメタクリレート、グリセロールメタクリレート、ヒドロキシプロピルメタクリレート、N-ビニルピロリドンおよびヒドロキシブチルメタクリレートからなる群より選択される、請求項1または2に記載のマトリックス制御拡散薬物送達システム。

【請求項7】

以下：

【化2】



を含むフッ化側鎖シロキサンコポリマーであって、ここで、 R_1 基は、 C_{1-7} アルキル

および C_{6-10} アリールからなる群より選択され、同じであっても異なってもよく； R_2 基は、 C_{1-7} アルキレンであり； x は、26未満の自然数であり； p および q は、同じであっても異なってもよい、100未満の自然数であり、そして z は、11未満の自然数である、コポリマー。

【請求項 8】

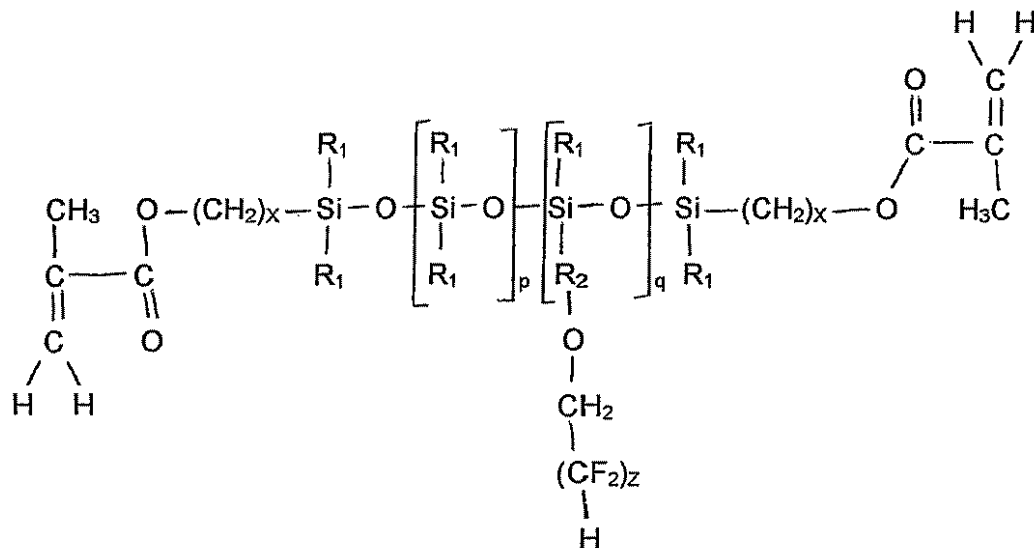
マトリックス制御拡散薬物送達システムを作製する方法であって、

フッ化側鎖シロキサンコポリマーを、治療有効量の少なくとも 1 つの薬学的に活性な薬剤および必要に応じて 1 つ以上のモノマーと重合させる工程を包含する、方法。

【請求項 9】

マトリックス制御拡散薬物送達システムを作製する方法であって、

【化 3】



によって表されるフッ化側鎖シロキサンコポリマーを、治療有効量の少なくとも 1 つの薬学的に活性な薬剤および必要に応じて 1 つ以上のモノマーと重合させる工程を包含し、ここで、 R_1 基は、 C_{1-7} アルキルおよび C_{6-10} アリールからなる群より選択され、同じであっても異なってもよく； R_2 基は、 C_{1-7} アルキレンであり； x は、26未満の自然数であり； p および q は、同じであっても異なってもよい、100未満の自然数であり、そして z は、11未満の自然数である、方法。

【請求項 10】

マトリックス制御拡散薬物送達システムを作製する方法であって、以下：

過フッ化側鎖コポリマーを有する、メタクリレートでキャップされたシロキサンを調製する工程；

該過フッ化側鎖コポリマーを有する、メタクリレートでキャップされたシロキサンを、1 つ以上のモノマーおよび治療有効量の少なくとも 1 つの薬学的に活性な薬剤と共重合する工程

を包含する、方法。

【請求項 11】

前記少なくとも 1 つの薬学的に活性な薬剤が、抗緑内障剤、抗白内障剤、抗糖尿病性網膜症剤、チオール架橋剤、抗癌剤、免疫モジュレーター、抗凝固剤、抗組織傷害剤、抗炎症剤、抗線維剤、非ステロイド性抗炎症剤、抗生物質、抗病原体剤、ピペラジン誘導体、毛様体筋麻痺剤および散瞳剤からなる群より選択される、請求項 8、9 または 10 に記載の方法。

【請求項 12】

前記少なくとも 1 つの薬学的に活性な薬剤が、抗コリン作用性薬剤、抗凝血剤、抗フィブリン溶解剤、抗ヒスタミン剤、抗マラリア剤、抗毒素、キレート剤、ホルモン、免疫抑制剤、血栓溶解剤、ビタミン、塩、減感作剤、プロスタグランジン、アミノ酸、代謝産物

および抗アレルギー性物質からなる群より選択される、請求項 8、9 または 10 に記載の方法。

【請求項 13】

前記少なくとも 1 つの薬学的に活性な薬剤が、ヒドロコルチゾン、ゲンタマイシン、5 - フルオロウラシル、ソルビニル、インターロイキン - 2、ファーケン - a、チオロア - チオプロニン、ベンダザック、アセチルサルチル酸、フルオシノロンアセトニド、トリフルオロチミジン、インターフェロン、免疫モジュレーターおよび増殖因子からなる群より選択される、請求項 8、9 または 10 に記載の方法。

【請求項 14】

前記 1 つ以上モノマーが、メチルメタクリレート、N, N - ジメチルアクリルアミド、アクリルアミド、N - メチルアクリルアミド、2 - ヒドロキシエチルメタクリレート、ヒドロキシジエチルメタクリレート、メトキシエチルメタクリレート、メトキシエトキシエチルメタクリレート、メトキシジエトキシエチルメタクリレート、ポリ(エチレングリコール)メタクリレート、メトキシ - ポリ(エチレングリコール)メタクリレート、メタクリル酸、ナトリウムメタクリレート、グリセロールメタクリレート、ヒドロキシプロピルメタクリレート、N - ビニルピロリドンおよびヒドロキシブチルメタクリレートからなる群より選択される、請求項 8、9 または 10 に記載の方法。