

【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1部門第2区分
 【発行日】平成26年6月26日(2014.6.26)

【公表番号】特表2013-526347(P2013-526347A)
 【公表日】平成25年6月24日(2013.6.24)
 【年通号数】公開・登録公報2013-033
 【出願番号】特願2013-510249(P2013-510249)
 【国際特許分類】

A 6 1 L 31/00 (2006.01)
 A 6 1 K 47/14 (2006.01)
 A 6 1 K 47/34 (2006.01)
 A 6 1 K 47/48 (2006.01)
 A 6 1 K 47/24 (2006.01)

【F I】

A 6 1 L 31/00 P
 A 6 1 K 47/14
 A 6 1 K 47/34
 A 6 1 K 47/48
 A 6 1 K 47/24
 A 6 1 L 31/00 Z

【手続補正書】

【提出日】平成26年5月9日(2014.5.9)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0126

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0126】

種々の特定のおよび好ましい実施形態および技術を参照しながら本発明を説明してきた。しかしながら、本発明の趣旨および範囲の枠内にとどまって多くの変更および修正を加えることを理解されたい。

本願発明は以下の態様を含む。

(態様1)

グリセロールエステルと、

前記グリセロールエステル内に分散された活性剤と、

を含む活性剤溶出デバイスであって、

前記グリセロールエステルから前記活性剤を溶出するように構成されている、上記活性剤溶出デバイス。

(態様2)

前記活性剤溶出デバイスが、前記グリセロールエステルの分解に応答して前記活性剤を溶出するように構成されている、態様1または3~38のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様3)

前記グリセロールエステルの分解が *in vivo* 条件下で起こる、態様1~2または4~38のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様4)

前記グリセロールエステルがグリセロールエステルポリマーを含む、態様1~3または5~38のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 5)

前記グリセロールエステルポリマーが 5,000 以上の分子量を含む、態様 1 ~ 4 または 6 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 6)

前記グリセロールエステルがグリセロールとカルボン酸とのエステル化反応生成物を含む、態様 1 ~ 5 または 7 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 7)

前記カルボン酸が二つ以上のカルボン酸基を含む、態様 1 ~ 6 または 8 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 8)

前記カルボン酸が脂肪酸を含む、態様 1 ~ 7 または 9 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 9)

前記グリセロールエステルがグリセロールと酸クロリドとのエステル化反応生成物を含む、態様 1 ~ 8 または 10 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 10)

前記ポリグリセロールエステルが摂氏約 25 度超かつ摂氏約 37 度未満の融解温度 T_m を有する、態様 1 ~ 9 または 11 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 11)

前記グリセロールエステルが、2 個以上の炭素原子を含む炭素鎖を含むエステル基を含む、態様 1 ~ 10 または 12 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 12)

前記グリセロールエステルが、6 個以上の炭素原子を含む炭素鎖を含むエステル基を含む、態様 1 ~ 11 または 13 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 13)

前記グリセロールエステルが、プロドラッグを含むエステル基を含む、態様 1 ~ 12 または 14 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 14)

前記グリセロールエステルが、共有結合された抗炎症剤を含むエステル基を含む、態様 1 ~ 13 または 15 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 15)

前記グリセロールエステルが、サリチレートを含むエステル基を含む、態様 1 ~ 14 または 16 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 16)

前記グリセロールエステルが、結合基を介して基材の表面に共有結合されている、態様 1 ~ 15 または 17 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 17)

前記結合基がシラン化合物を含む、態様 1 ~ 16 または 18 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 18)

前記グリセロールエステルが、光反応性基の残基を介して基材の表面に共有結合されている、態様 1 ~ 17 または 19 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 19)

前記光反応性基がアリアルケトンを含む、態様 1 ~ 18 または 20 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 20)

前記グリセロールエステルが架橋剤により架橋されている、態様 1 ~ 19 または 21 ~ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 21)

前記グリセロールエステルが、光反応性基を含む架橋剤により架橋されている、態様 1

～ 20 または 22 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 22)

前記ポリグリセロールエステル内に分散された生体適合性ポリマーをさらに含む、態様 1 ～ 21 または 23 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 23)

前記生体適合性ポリマーが分解性ポリマーを含む、態様 1 ～ 22 または 24 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 24)

前記生体適合性ポリマーが疎水性ポリマーを含む、態様 1 ～ 23 または 25 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 25)

疎水性ポリマーをさらに含み、前記ポリグリセロールエステルが前記疎水性ポリマーに対する溶媒として機能する、態様 1 ～ 24 または 26 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 26)

前記ポリグリセロールエステル内に配置された微粒子をさらに含む、態様 1 ～ 25 または 27 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 27)

前記微粒子がポリエチレングリコール含有コポリマーを含む、態様 1 ～ 26 または 28 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 28)

前記微粒子が、ポリラクチド、ポリグリコリド、ポリカプロラクトン、またはそれらのコポリマーの少なくとも一つを含むことを含む、態様 1 ～ 27 または 29 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 29)

前記グリセロールエステルのグリセロール骨格が完全エステル化されており、かつ前記活性剤が疎水性である、態様 1 ～ 28 または 30 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 30)

前記ポリグリセロールエステルが摂氏 37 度で 1,000 ～ 30,000 cP (センチポアズ) の粘度を有する、態様 1 ～ 29 または 31 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 31)

前記活性剤が疎水性活性剤を含む、態様 1 ～ 30 または 32 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 32)

前記活性剤が親水性活性剤を含む、態様 1 ～ 31 または 33 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 33)

前記活性剤が、組み合わせられたポリグリセロールおよび活性剤の約 1 wt. % ～ 約 50 wt. % を構成する、態様 1 ～ 32 または 34 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 34)

前記活性剤溶出デバイスが埋め込み型医療デバイスを含む、態様 1 ～ 33 または 35 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 35)

前記活性剤溶出デバイスがアイコイルを含む、態様 1 ～ 34 または 36 ～ 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 36)

前記活性剤溶出デバイスがバルーンカテーテルを含む、態様 1 ～ 35 または 37 ～ 38

のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 37)

前記グリセロールエステルが高分子骨格上のペンダント基である、態様 1 ~ 36 または 38 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 38)

前記グリセロールエステルが高分子骨格の一部である、態様 1 ~ 37 のいずれか一つに記載の活性剤溶出デバイス。

(態様 39)

式：

A B、A B A、B A B、またはそれらの混合物

(式中、

A は、グリセロールエステルブロックを表し、かつ

B は、ポリ-ラクチド-コ-グリコリド (P L G A)、ならびにポリエチレングリコール (P E G)、ポリエステル、ポリウレタン、およびポリカーボネートよりなる群から選択される少なくとも 1 つのブロックを表し、B ブロックは、コポリマーの約 1 ~ 約 99 w t . % を構成する)

で示されるブロックコポリマーを含む、医療デバイス。

(態様 40)

グリセロールエステルと、

前記グリセロールエステル内に分散された活性剤と、
を含む組成物であって、

前記グリセロールエステルから前記活性剤を溶出するように構成されている、組成物。

(態様 41)

前記活性剤溶出デバイスが、前記グリセロールエステルの分解にตอบสนองして前記活性剤を溶出するように構成されている、態様 40 または 42 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 42)

前記グリセロールエステルの分解が *i n v i v o* 条件下に起こる、態様 40 ~ 41 または 43 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 43)

前記グリセロールエステルがグリセロールエステルポリマーを含む、態様 40 ~ 42 または 44 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 44)

前記グリセロールエステルポリマーが 5 , 0 0 0 以上の分子量を含む、態様 40 ~ 43 または 45 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 45)

前記グリセロールエステルがグリセロールとカルボン酸とのエステル化反応生成物を含む、態様 40 ~ 44 または 46 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 46)

前記カルボン酸が二つ以上のカルボン酸基を含む、態様 40 ~ 45 または 47 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 47)

前記カルボン酸が脂肪酸を含む、態様 40 ~ 46 または 48 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 48)

前記グリセロールエステルがグリセロールと酸クロリドとのエステル化反応生成物を含む、態様 40 ~ 47 または 49 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 49)

前記ポリグリセロールエステルが摂氏約 25 度超かつ摂氏約 37 度未満の融解温度 T_m を有する、態様 40 ~ 48 または 50 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 0)

前記グリセロールエステルが、2個以上の炭素原子を含む炭素鎖を含むエステル基を含む、態様40～49または51～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 1)

前記グリセロールエステルが、6個以上の炭素原子を含む炭素鎖を含むエステル基を含む、態様40～50または52～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 2)

前記グリセロールエステルが、プロドラッグを含むエステル基を含む、態様40～51または53～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 3)

前記グリセロールエステルが、共有結合された抗炎症剤を含むエステル基を含む、態様40～52または54～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 4)

前記グリセロールエステルが、サリチレートを含むエステル基を含む、態様40～53または55～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 5)

前記グリセロールエステルが、結合基を介して基材の表面に共有結合されている、態様40～54または56～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 6)

前記結合基がシラン化合物を含む、態様40～55または57～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 7)

前記グリセロールエステルが、光反応性基の残基を介して基材の表面に共有結合されている、態様40～56または58～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 8)

前記光反応性基がアリールケトンを含む、態様40～57または59～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 5 9)

前記グリセロールエステルが架橋剤により架橋されている、態様40～58または60～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 6 0)

前記グリセロールエステルが、光反応性基を含む架橋剤により架橋されている、態様40～59または61～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 6 1)

前記ポリグリセロールエステル内に分散された生体適合性ポリマーをさらに含む、態様40～60または62～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 6 2)

前記生体適合性ポリマーが分解性ポリマーを含む、態様40～61または63～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 6 3)

前記生体適合性ポリマーが疎水性ポリマーを含む、態様40～62または64～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 6 4)

疎水性ポリマーをさらに含み、前記ポリグリセロールエステルが前記疎水性ポリマーに対する溶媒として機能する、態様40～63または65～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 6 5)

前記ポリグリセロールエステル内に配置された微粒子をさらに含む、態様40～64または66～72のいずれか一つに記載の組成物。

(態 様 6 6)

前記微粒子がポリエチレングリコール含有コポリマーを含む、態様 40 ~ 65 または 67 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 67)

前記微粒子が、ポリラクチド、ポリグリコリド、ポリカプロラクトン、またはそれらのコポリマーの少なくとも一つを含むことを含む、態様 40 ~ 66 または 68 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 68)

前記グリセロールエステルのグリセロール骨格が完全エステル化されており、かつ前記活性剤が疎水性である、態様 40 ~ 67 または 69 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 69)

前記ポリグリセロールエステルが摂氏 37 度で 1,000 ~ 30,000 cP (センチポアズ) の粘度を有する、態様 40 ~ 68 または 70 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 70)

前記活性剤が疎水性活性剤を含む、態様 40 ~ 69 または 71 ~ 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 71)

前記活性剤が親水性活性剤を含む、態様 40 ~ 70 または 72 のいずれか一つに記載の組成物。

(態様 72)

前記活性剤が、組み合わされたポリグリセロールおよび活性剤の約 1 wt. % ~ 約 50 wt. % を構成する、態様 40 ~ 71 のいずれか一つに記載の組成物。

【手続補正 2】

【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】

10,000 以上の分子量を有するグリセロールエステルポリマーであって、前記グリセロールエステルは、共有結合された抗炎症剤を含むエステル基を含み、前記グリセロールエステルポリマーは、ポリグリセロール骨格を含み且つグリセロールオリゴマーまたはポリマーとカルボン酸とのエステル化反応生成物である、グリセロールエステルポリマーと、

前記グリセロールエステル内に分散された活性剤と、
を含む活性剤溶出デバイスであって、

前記グリセロールエステルから前記活性剤を溶出するように構成されている、上記活性剤溶出デバイス。

【請求項 2】

前記活性剤溶出デバイスが、前記グリセロールエステルの分解に応答して前記活性剤を溶出するように構成されている、請求項 1 に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 3】

前記カルボン酸が二つ以上のカルボン酸基を含む、請求項 1 または 2 に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 4】

前記カルボン酸が脂肪酸を含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 5】

前記ポリグリセロールエステルが摂氏約 25 度超かつ摂氏約 37 度未満の融解温度 T_m

を有する、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 6】

前記グリセロールエステルが、6 個以上の炭素原子を含む炭素鎖を含むエステル基を含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 7】

前記グリセロールエステルが、サリチレートを含むエステル基を含む、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 8】

前記グリセロールエステルが、結合基を介して基材の表面に共有結合されている、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 9】

前記結合基がシラン化合物を含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 10】

前記グリセロールエステルが、光反応性基の残基を介して基材の表面に共有結合されている、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 11】

前記光反応性基がアリアルケトンを含む、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 12】

前記ポリグリセロールエステル内に配置された微粒子をさらに含む、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 13】

前記微粒子がポリエチレングリコール含有コポリマーを含む、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。

【請求項 14】

前記微粒子が、ポリラクチド、ポリグリコリド、ポリカプロラクトン、またはそれらのコポリマーの少なくとも 1 つを含むことを含む、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の活性剤溶出デバイス。