

【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】令和4年3月16日(2022.3.16)

【国際公開番号】WO2019/175106
 【公表番号】特表2021-515791(P2021-515791A)
 【公表日】令和3年6月24日(2021.6.24)
 【出願番号】特願2020-548759(P2020-548759)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 9/70(2006.01)

A 6 1 K 47/34(2017.01)

A 6 1 K 47/32(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/32

【手続補正書】

【提出日】令和4年3月8日(2022.3.8)

【手続補正1】

20

【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】

活性剤含有層構造を含む、活性剤の経皮投与のための経皮治療システムであって、前記活性剤含有層構造は、

A) 裏地層と、

B) 活性剤含有層であって、

a) 治療的有効量の前記活性剤と、

b) 少なくとも1つのシリコンアクリルハイブリッドポリマーと、を含む、前記活性剤含有層と、

C) 皮膚接触層と、を含む、前記経皮治療システム。

30

【請求項2】

請求項1に記載の経皮治療システムであって、

前記活性剤含有層が、活性剤含有マトリックス層、好ましくは活性剤含有感圧接着剤層である、前記経皮治療システム。

【請求項3】

請求項1または2に記載の経皮治療システムであって、

前記活性剤含有層が、前記活性剤含有層を基準として、20重量%~98重量%、好ましくは30重量%~95重量%、より好ましくは50重量%~95重量%の量で前記シリコンアクリルハイブリッドポリマーを含有する、前記経皮治療システム。

40

【請求項4】

請求項1~3のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、

前記シリコンアクリルハイブリッドポリマーが、連続的なシリコン外部相及び不連続的なアクリル内部相を含有するか、または連続的なアクリル外部相及び不連続的なシリコン内部相を含有する、前記経皮治療システム。

【請求項5】

請求項1~4のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、

50

前記少なくとも1つのシリコンアクリルハイブリッドポリマーが、好ましくは5 : 9 5 ~ 9 5 : 5、より好ましくは4 0 : 6 0 ~ 6 0 : 4 0というシリコン対アクリレートの重量比を有するシリコンアクリルハイブリッド感圧接着剤である、前記経皮治療システム。

【請求項6】

請求項5に記載の経皮治療システムであって、

前記少なくとも1つのシリコンアクリルハイブリッド感圧接着剤が、2 5 及び酢酸エチル中5 0 %の固形分含有量で4 0 0 c P超、好ましくは5 0 0 c P ~ 3 , 5 0 0 c Pの溶液粘度を特徴とする、及び/または

前記少なくとも1つのシリコンアクリルハイブリッド感圧接着剤は、3 0 において0 . 1 r a d / sで1 . 0 e 9 ポアズ未満、好ましくは1 . 0 e 5 ポアズ ~ 9 . 0 e 8 ポアズの複素粘度を特徴とする、前記経皮治療システム。

10

【請求項7】

請求項1 ~ 6のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、

前記シリコンアクリルハイブリッドポリマーが、

(a) アクリレートまたはメタクリレート官能基を含むケイ素含有感圧接着剤組成物と、

(b) エチレン性不飽和モノマーと、

(c) 開始剤と、

の反応生成物を含むシリコンアクリルハイブリッド感圧接着剤であり、

好ましくは、前記アクリレートまたはメタクリレート官能基を含むケイ素含有感圧接着剤組成物が、

20

(a 1) シリコン樹脂と、

(a 2) シリコンポリマーと、

(a 3) アクリレートまたはメタクリレート官能基を含むケイ素含有封止剤と、

の縮合反応生成物である、前記経皮治療システム。

【請求項8】

請求項7に記載の経皮治療システムであって、

前記エチレン性不飽和モノマーが、脂肪族アクリレート、脂肪族メタクリレート、脂環式アクリレート、脂環式メタクリレート、及びそれらの組み合わせからなる群より選択され、前記化合物の各々は、アルキル基中に最大で2 0 個の炭素原子を有し、好ましくは、前記エチレン性不飽和モノマーが、4 0 : 6 0 ~ 7 0 : 3 0の比、好ましくは6 5 : 3 5 ~ 5 5 : 4 5または5 5 : 4 5 ~ 4 5 : 5 0の比の2 - エチルヘキシルアクリレート及びメチルアクリレートの組み合わせである、前記経皮治療システム。

30

【請求項9】

請求項1 ~ 8のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、

前記シリコンアクリルハイブリッドポリマーは、シリコンポリマー、シリコン樹脂及びアクリルポリマーの反応生成物を含み、前記アクリルポリマーは、共有結合で自己架橋しており、前記シリコンポリマー及び/または前記シリコン樹脂に共有結合している、前記経皮治療システム。

【請求項10】

40

請求項1 ~ 9のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、

前記経皮治療システムが、少なくとも1つの非ハイブリッドポリマーをさらに含み、好ましくは、前記少なくとも1つの非ハイブリッドポリマーが、ポリシロキサン、ポリイソブチレン、スチレン - イソブレン - スチレンブロックコポリマー、アクリレート、またはそれらの混合物をベースとする非ハイブリッド感圧接着剤であり、より好ましくは、前記少なくとも1つの非ハイブリッドポリマーが、ポリシロキサンまたはアクリレートをベースとする、非ハイブリッド感圧接着剤である、前記経皮治療システム。

【請求項11】

請求項10に記載の経皮治療システムであって、

前記少なくとも1つの非ハイブリッドポリマーが、前記皮膚接触層中に、好ましくは前記

50

皮膚接触層を基準として、30重量%～100重量%の量で含有される、前記経皮治療システム。

【請求項12】

請求項1または11に記載の経皮治療システムであって、前記活性剤含有層が、前記治療的有効量の活性剤及びカルボン酸を含む内相を有し、かつ前記少なくとも1つのシリコンアクリルハイブリッドポリマーを含む外相を有する活性剤含有二相性マトリックス層であり、前記内相は、前記外相中に分散堆積物を形成する、前記経皮治療システム。

【請求項13】

請求項1～12のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、前記活性剤含有層が、非ハイブリッドポリマーをさらに含む、前記経皮治療システム。

10

【請求項14】

請求項1～13のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、前記活性剤が、前記活性剤含有層を基準として、2重量%～40重量%、好ましくは3重量%～40重量%、より好ましくは5重量%～35重量%の量で含有されている、前記経皮治療システム。

【請求項15】

請求項14に記載の経皮治療システムであって、前記カルボン酸が、前記治療的有効量の活性剤がそれに可溶化されるのに十分な量で含有されており、好ましくは前記カルボン酸が、C₃～C₂₄カルボン酸からなる群より選択される、前記経皮治療システム。

20

【請求項16】

請求項1～15のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、前記活性剤含有層の領域重量が、20～160g/m²、好ましくは30～140g/m²の範囲であり、かつ前記皮膚接触層の領域重量が5～120g/m²、好ましくは5～50g/m²の範囲である、前記経皮治療システム。

【請求項17】

請求項1～16のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、前記活性剤含有層がさらに、前記活性剤含有層を基準として、好ましくは、0.5重量%～30重量%の量で補助ポリマーをさらに含む、前記経皮治療システム。

30

【請求項18】

請求項17に記載の経皮治療システムであって、前記補助ポリマーが、アルキルメタクリレートコポリマー、アミノアルキルメタクリレートコポリマー、メタクリル酸コポリマー、メタクリル酸エステルコポリマー、アンモニオアルキルメタクリレートコポリマー、ポリビニルピロリドン、ビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルカプロラクタム-ポリ酢酸ビニル-ポリエチレングリコールコポリマー、及びそれらの混合物からなる群より選択される、前記経皮治療システム。

【請求項19】

請求項1～18のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、前記活性剤含有層構造が、0.9N～8.0N、好ましくは0.9N超～8.0N、より好ましくは1.2N超～6.0Nのタックを提供する、前記経皮治療システム。

40

【請求項20】

請求項1～19のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、抗菌剤として0.1%アジ化生理食塩水を有するリン酸緩衝液pH5.5を32±1の温度で使用した場合に、フランツ拡散セルで測定され、投与期間のおよそ最後の3分の2にわたって、好ましくは7日の投与期間のうち最後の4日にわたって、20%のポイント以内で一定である、前記活性剤の透過速度を提供する、前記経皮治療システム。

【請求項21】

請求項1～20のいずれか1項に記載の経皮治療システムであって、前記活性剤がブプレノルフィンである、前記経皮治療システム。

50

【請求項 2 2】

請求項 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の経皮治療システムであって、
好ましくは、前記経皮治療システムが、患者の皮膚に、好ましくは少なくとも 2 4 時間、
8 4 時間、または 1 6 8 時間適用される、治療のための、好ましくは疼痛の治療のための
前記経皮治療システム。

【請求項 2 3】

請求項 1 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の経皮治療システムの製造方法であって、

1) 活性剤含有コーティング組成物であって、

a) 前記活性剤、及び

b) 必要に応じて溶媒、を含む

10

前記活性剤含有コーティング組成物を提供する工程と、

2) 前記活性剤含有コーティング組成物を所望の領域重量を提供するための量でフィルム
上にコーティングする工程と、

3) 前記コーティングされた活性剤含有コーティング組成物を乾燥させて、前記活性剤含
有層を提供する工程と、

4) 工程 2 及び 3 による追加のコーティング組成物をコーティング及び乾燥することによ
って追加の皮膚接触層を提供する工程であって、前記フィルムが離型ライナーである、前
記工程と、

5) 前記皮膚接触層の接着面を前記活性剤含有層の接着面に積層して、所望の放出領域を
有する活性剤含有層構造を提供する工程と、

20

6) 前記活性剤含有層構造から個々のシステムを打ち抜く工程と、

7) 裏地層及び活性剤非含有感圧接着剤層を同様に含み、かつ活性剤含有自己接着性層構
造の個々のシステムよりも大きな活性剤非含有自己接着性層構造を、前記個々のシステム
に必要に応じて接着させる工程と、を含み、

少なくとも 1 つのシリコンアクリルハイブリッドポリマー組成物が、工程 1 で活性剤含
有コーティング組成物に添加される、前記経皮治療システムの製造方法。

30

40

50