【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29年12月14日(2017.12.14)

【公表番号】特表2017-500282(P2017-500282A)
【公表日】平成29年1月5日(2017.1.5)
【年通号数】公開・登録公報2017-001
【出願番号】特願2016-527321(P2016-527321)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/5575　(2006.01)
Ａ６１Ｆ　 9/007　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　27/06　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/16　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/34　(2017.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/5575
Ａ６１Ｆ　 9/007　１７０
Ａ６１Ｆ　 9/007　１６０
Ａ６１Ｐ　27/06
Ａ６１Ｋ　 9/16
Ａ６１Ｋ　47/34

【手続補正書】
【提出日】平成29年10月31日(2017.10.31)
【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】
目における眼圧（ＩＯＰ）を低減するための生分解性眼内インプラントであって、
生分解性ポリマーマトリクス、ポリエチレングリコール３３５０、及び活性薬剤としてのプロスタミドを含み、前記プロスタミド及びポリエチレングリコール３３５０が前記生分解性ポリマーマトリクスと関連し、前記生分解性ポリマーマトリクスが、
ａ）０．２５～０．３５ｄｌ／ｇの固有粘度を有するエステル末端ポリ（Ｄ，Ｌ－ラクチド）、
ｂ）０．１６～０．２４ｄｌ／ｇの固有粘度を有する酸末端ポリ（Ｄ，Ｌ－ラクチド）、並びに
ｃ）０．１６～０．２４ｄｌ／ｇの固有粘度及び約７５：２５のグリコリドに対するＤ，Ｌ－ラクチドのモル比を有するエステル末端（Ｄ，Ｌ－ラクチド－グリコリド）共重合体
を含み、
前記プロスタミドが前記インプラントの１８～２２重量％を構成し、前記エステル末端ポリ（Ｄ，Ｌ－ラクチド）が前記インプラントの１８～２２重量％を構成し、前記酸末端ポリ（Ｄ，Ｌ－ラクチド）が前記インプラントの１３．５～１６．５重量％を構成し、前記エステル末端（Ｄ，Ｌ－ラクチド－グリコリド）共重合体が前記インプラントの３６～４４重量％を構成し、
前記ポリエチレングリコール３３５０が前記インプラントの３．５～６．５重量％を構成し、

但し、前記ポリ（Ｄ，Ｌ－ラクチド）及び（Ｄ，Ｌ－ラクチド－グリコリド）共重合体ポリマーのそれぞれの固有粘度が、当該ポリマーの０．１％クロロホルム溶液に対して２５℃で測定される、前記インプラント。

【請求項２】

前記プロスタミドが前記インプラントの２０重量％を構成し、前記エステル末端ポリ（Ｄ，Ｌ－ラクチド）が前記インプラントの２０重量％を構成し、前記酸末端ポリ（Ｄ，Ｌ－ラクチド）が前記インプラントの１５重量％を構成し、前記エステル末端（Ｄ，Ｌ－ラクチド－グリコリド）共重合体が前記インプラントの４０重量％を構成し、前記ポリエチレングリコール３３５０が前記インプラントの５重量％を構成する、請求項１に記載の生分解性眼内インプラント。

【請求項３】

ロッド形状であり、加熱溶融押出プロセスによって成形され、径または幅が１５０μｍ～３００μｍ、長さが０．５０ｍｍ～２．５ｍｍ、全重量が３０μｇ～１００μｇである、請求項１または２に記載のインプラント。

【請求項４】

目の前房内への配置後に角膜内皮に接触しない、請求項１～３のいずれか１項に記載のインプラント。

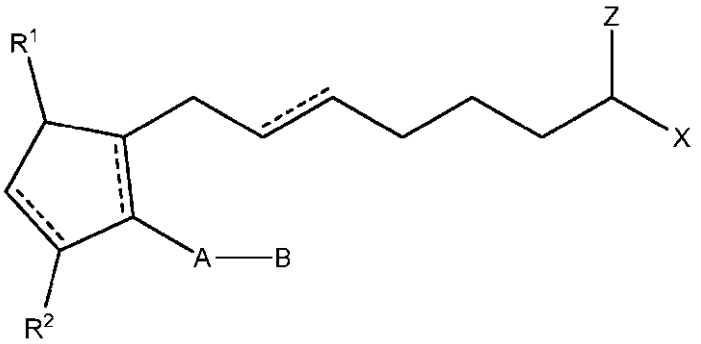
【請求項５】

目の中への配置後２ヶ月以上、当該の目における眼圧の低減に有効である、請求項１～４のいずれか１項に記載のインプラント。

【請求項６】

前記プロスタミドが式（Ｉ）

【化１】



式中、

破線の結合は、単結合またはｃｉｓ若しくはｔｒａｎｓ配座であることができる二重結合を表わし、

Ａは、１または複数のオキシド基が間に挿入されていてもよく、１または複数のヒドロキシ、オキソ、アルキルオキシまたはアルキルカルボキシ基、但し、前記アルキル基は１～６の炭素原子を含む、によって置換されていてもよい、２～６の炭素原子を有するアルキレンまたはアルケニレン基であり、

Ｂは３～７の炭素原子を有するシクロアルキル基、またはヒドロカルビルアリール及び、４～１０の炭素原子を有する複素アリール基であって、複素原子が窒素、酸素及びイオウ原子からなる群より選択される前記複素アリール基からなる群より選択されるアリール基であり、

Ｘは－Ｎ（Ｒ^{4}）$_{2}$、但し、Ｒ^{4}は水素及び１～６の炭素原子を有する低級アルキル基からなる群より独立に選択される、であり

Ｚは＝Ｏであり、

Ｒ^{1}及びＲ^{2}の一方は＝Ｏ、－ＯＨ若しくは－Ｏ（ＣＯ）Ｒ^{6}基であり、且つＲ^{1}及びＲ^{2}の他方は－ＯＨ若しくは－Ｏ（ＣＯ）Ｒ^{6}基であるか、あるいはＲ^{1}は＝Ｏ、且つＲ^{2}はＨ、但し、Ｒ^{6}は１～約２０の炭素原子を有する飽和若しくは不飽和の非環状炭化水素基、

または－（CH_2）mR^7、但し、mは０若しくは１～１０の整数、R^7は３～７の炭素原子を有するシクロアルキル基、またはヒドロカルビルアリール若しくは前記に定義した複素アリール基である
を有する化合物である、請求項１～５のいずれか１項に記載のインプラント。
【請求項７】
前記プロスタミドがビマトプロストである、請求項１～５のいずれか１項に記載のインプラント。
【請求項８】
哺乳動物の目における眼圧を低減する為の請求項１または２に記載の生分解性眼内インプラントであって、前記インプラントが、前記目における眼圧を低減するために有効な量でプロスタミドを前記目に提供する、前記インプラント。
【請求項９】
前記哺乳動物が、眼圧亢進、高眼圧症、または緑内障を有するヒトの患者である、請求項８に記載のインプラント。
【請求項１０】
前記患者の目の前房内に配置される、請求項８または９に記載のインプラント。
【請求項１１】
目の前房内への配置後少なくとも２ヶ月の間、目における眼圧の低減に有効である、請求項８～１０のいずれか１項に記載のインプラント。
【請求項１２】
前記プロスタミドがビマトプロストである、請求項８～１１のいずれか１項に記載のインプラント。
【請求項１３】
押出プロセスによって成形され、径または幅が１５０～３００μｍ、長さが０．５０～２．５ｍｍ、全重量が３０～１００μｇである、請求項８～１２のいずれか１項に記載のインプラント。
【請求項１４】
目の前房内に配置後に角膜内皮に接触しない、請求項８～１３のいずれか１項に記載のインプラント。
【請求項１５】
前記インプラントが眼内送達装置を用いて目（複数可）の中に配置され、
前記装置は細長い筐体及び前記筐体から長手方向に延在するカニューレを備え、
前記カニューレは近位端及び鋭利な遠位端を有し、且つ当該カニューレに沿って延在する内腔を有し、
前記内腔は、前記インプラントを受け入れるため、及び該インプラントが該内腔を通って患者の目の中へと並進移動することを可能にするために十分な内径を有する、請求項８～１４のいずれか１項に記載のインプラント。
【請求項１６】
生分解性眼内インプラントの患者の目の中への送達装置であって、
請求項１に記載の眼内インプラント、細長い筐体及び前記筐体から長手方向に延在するカニューレを備え、
前記カニューレは近位端、鋭利な遠位端、及び当該カニューレに沿って延在する内腔を有し、
前記内腔は、前記インプラントを受け入れるため、及び該インプラントが該内腔を通って患者の目の中へと並進移動することを可能にするために十分な内径を有する、前記送達装置。
【請求項１７】
前記カニューレが２５ゲージ、２６ゲージ、２７ゲージ、２８ゲージ、２９ゲージ、または３０ゲージの針である、請求項１６に記載の装置。
【請求項１８】

請求項１に記載の生分解性眼内インプラントの製造方法であって、
前記プロスタミドを前記ポリ（Ｄ，Ｌ－ラクチド）及び（Ｄ，Ｌ－ラクチド－グリコリド）共重合体ポリマー並びにポリエチレングリコール３３５０と混合することと、
前記混合物を押出してフィラメントを成形することと、それに続いて前記フィラメントを眼の前房または硝子体内への配置に適した長さに切断し、それによって眼内インプラントを成形することとを含む、前記製造方法。