

【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】平成17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2005-511794(P2005-511794A)

【公表日】平成17年4月28日(2005.4.28)

【年通号数】公開・登録公報2005-017

【出願番号】特願2003-512327(P2003-512327)

【国際特許分類第7版】

C 0 9 J 133/06

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 47/32

C 0 9 J 7/02

C 0 9 J 133/00

C 0 9 J 133/14

C 0 9 J 155/00

// C 0 9 J 139/00

【F I】

C 0 9 J 133/06

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 47/32

C 0 9 J 7/02 Z

C 0 9 J 133/00

C 0 9 J 133/14

C 0 9 J 155/00

C 0 9 J 139/00

【手続補正書】

【提出日】平成17年4月1日(2005.4.1)

【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】

(a) アルキル基中に4~12個の炭素原子を含むアルキルアクリレートおよびアルキル基中に4~12個の炭素原子を含むアルキルメタクリレートからなる群より選択される少なくとも1種のAモノマー、および

(b) ピロリドノエチルアクリレートおよびピロリドノエチルメタクリレートからなる群より選択される少なくとも1種のピロリドンモノマー、を含むコポリマーを含む感圧接着剤組成物。

【請求項2】

前記Aモノマーが、イソオクチルアクリレート、2-エチルヘキシルアクリレート、ブチルアクリレート、およびシクロヘキシルアクリレートからなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記ピロリドンモノマーがピロリドノエチルアクリレートである、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記コポリマーがマクロモノマーをさらに含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

前記組成物が治療すべき適応症に対して治療的に有効な量を送達するような量の薬物をさらに含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

バッキングおよび請求項5に記載の組成物を含む経皮送達デバイスであって、前記組成物が前記バッキングの表面の少なくとも一部にコーティングされている経皮送達デバイス。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0020

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0020】

経皮による送達が適しているような薬物ならばどのようなものであっても、本発明の経皮薬物送達組成物に使用することができる。有用な薬物の例を挙げれば（これらに限定される訳ではない）、抗炎症薬でステロイド系（たとえば、ヒドロコルチゾン、プレドニゾロン、トリアムシノロン）および非ステロイド系（たとえば、ナプロキセン、ピロキシカム）の両方；抗菌薬（たとえば、ペニシリンVのようなペニシリン類、セファレキシンのようなセファロスポリン類、エリスロマイシン、テトラサイクリン、ゲンタマイシン、スルファチアゾール、ニトロフラントイン、およびノルフロキサシン、フルメキンおよびイバフロキサシンのようなキノロン類）；抗原虫薬（たとえば、メトロニダゾール）；抗真菌薬（たとえば、ナイスタチン）；冠状血管拡張薬（たとえば、ニトログリセリン）；カルシウムチャネル遮断薬（たとえば、ニフェジピン、ジルチアゼム）；気管支拡張薬（たとえば、テオフィリン、ピルブテロール、サルメテロール、イソプロテレノール）；酵素阻害薬、たとえばコラゲナーゼ阻害薬、プロテアーゼ阻害薬、エラスターーゼ阻害薬、リポキシゲナーゼ阻害薬（たとえば、ジロイトン）、およびアンギオテンシン変換酵素阻害薬（たとえば、カプトプリル、リシノプリル）；その他の血圧降下薬（たとえば、プロプラノロール）；ロイコトリエン拮抗薬；抗潰瘍薬たとえばH2拮抗薬；ステロイド性ホルモン類（たとえば、プロゲステロン、テストステロン、エストラジオール）；抗ウイルス薬および／または免疫調節薬（たとえば、1-イソブチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミン、1-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミン、およびその他米国特許第4,689,338号に開示されている化合物、アシクロビル）；局所麻酔薬（たとえば、ベンゾカイン、プロポフォール）；強心薬（たとえば、ジギタリス、ジゴキシン）；鎮咳薬（たとえば、コデイン、デキストロメトルファン）；抗ヒスタミン薬（たとえば、ジフェンヒドラミン、クロルフェニラミン、テルフェナジン）；麻薬性鎮痛薬（たとえば、モルヒネ、フェンタニル）；ペプチドホルモン（たとえば、ヒトまたは動物成長ホルモン類、LHRH）；性ホルモン（たとえば、エストロゲン、テストステロン、黄体ホルモン類たとえばレボノルゲストレル、ノルエチンドロン、黄体ホルモン）；心臓作用性製品たとえば心房性ペプチド；タンパク質製品（たとえば、インスリン）；酵素（たとえば、抗プレーク酵素、リゾチーム、デキストラナーゼ）；鎮吐薬（たとえば、スコポラミン）；抗痙攣薬（たとえば、カルバマジン）；免疫抑制薬（たとえば、シクロスボリン）；精神治療薬（たとえば、ジアゼパム）；鎮静薬（たとえば、フェノバルビタール）；抗凝血薬（たとえば、ヘパリン）；鎮痛薬（たとえば、アセトアミノフェン）；抗片頭痛薬（たとえば、エルゴタミン、メラトニン、スマトリップタン）；抗不整脈薬（たとえば、フレカイニド）；鎮吐薬（たとえば、メタクロプロミド、オンダンセトロン）；抗がん薬（たとえば、メトレキサート）；神経病薬たとえば抗不安薬；止血薬；抗肥満薬；など、および医薬品として許容されるそれらの塩およびエステルなどがある。好適な薬物としては、アテノロールおよびフェンタニルが挙げられる。

【手続補正3】**【補正対象書類名】明細書****【補正対象項目名】0057****【補正方法】変更****【補正の内容】****【0057】****感圧接着剤めくれ(lift)試験**

感圧接着剤のリフト試験は、皮膚粘着力試験に伴い、貼り付け後に試験片が身体から試験途中に分離してしまう程度を主観的に評価するものである。皮膚粘着力を24時間および72時間後に試験する直前に、試験片を肉眼で観察して、試験片の縁部が皮膚から分離している程度を調べる。それぞれの試験片に、以下の尺度を用いて0から5までの数字による評点をつける：

0 = めくれ観察されず

1 = 極めてわずかな縁のめくれ

2 = 25%までの縁のめくれ

3 = 26~50%の縁のめくれ

4 = 51~75%の縁のめくれ

5 = 76~100%の縁のめくれ。

【手続補正4】**【補正対象書類名】明細書****【補正対象項目名】0115****【補正方法】変更****【補正の内容】****【0115】****実施例50~69**

実施例46の一般的な方法を使用して、一連の経皮的に薬物を送達するためのデバイスを調製した。すべての場合において、感圧接着剤コーティングには、3.0重量%のアテノロールを含み、使用したコポリマーはIOA/PEA/PMMA Mac(67/28/5; IV=0.52、実施例21)であった。以下の表7には、添加物の種類と量を示している。2.0cm²のパッチからヒト死体の皮膚への浸透を前述の試験方法を用いて測定した。レセプター流体のサンプルは6、12および24時間目に採取した。24時間累積フラックスおよびパーセント薬物浸透の平均値を、下記の表7に示すが、ここでそれぞれの値は独立した3つの測定の平均値である。

【手続補正5】**【補正対象書類名】明細書****【補正対象項目名】0146****【補正方法】変更****【補正の内容】****【0146】****実施例100~103****PEAとIOAとのコポリマーの調製**

125gのガラス瓶に、イソオクチルアクリレート(IOA)、ピロリドノエチルアクリレート(PEA)、2,2'-アゾビス(2'メチル-ブチロニトリル)、エチルアセテート、およびメタノールを表14に示した量で仕込んで、4種類のコポリマーを調製した。この内容物を、窒素を1リットル/分の流速で35秒間流してバージし、酸素除去をした。瓶を密封して、57にした回転式水浴中に24時間入れておき、実質的に完全に重合を行わせた。コポリマーは場合によっては、エチルアセテートおよびメチルアルコールを用いてさらに希釈した。固形分パーセントおよびインヘント粘度を測定した結果を下の表14に示す。