

【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28年10月20日(2016.10.20)

【公表番号】特表2015-532928(P2015-532928A)

【公表日】平成27年11月16日(2015.11.16)

【年通号数】公開・登録公報2015-071

【出願番号】特願2015-533220(P2015-533220)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 9/58 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 9/58

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/32

【手続補正書】

【提出日】平成28年9月2日(2016.9.2)

【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】

シェル及び充填材料を含む複数のマイクロカプセルを含む組成物であって、前記シェルが生体分解可能なポリマーを含み、そして前記充填材料が少なくとも第一の治療薬を含み、そして前記シェルが前記充填材料を封入する、組成物。

【請求項2】

前記マイクロカプセルの平均Dvが100 μm未満であり；選択的に

(i) 前記マイクロカプセルの平均Dvが90、80、70、60又は50 μm未満から選択される；および/又は

(ii) 前記組成物中の前記マイクロカプセルの少なくとも70%が、前記組成物中の前記マイクロカプセルの平均Dvから50%以下、異なる、

請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記マイクロカプセルの平均最大直線寸法が100、90、80、70、60、50、又は40 μm未満から選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記マイクロカプセルは、患者の眼内又は眼の周囲に導入されたときに少なくとも30日間の期間にわたって治療薬を放出するように調合され；選択的に、前記マイクロカプセルは、患者の眼内又は眼の周囲に導入されたときに少なくとも90日間の期間にわたって治療薬を放出するように調合され；選択的に、前記マイクロカプセルは、患者の眼内又は眼の周囲に導入されたときに少なくとも180日間の期間にわたって治療薬を放出するように調合される、請求項1に記載の組成物。

**【請求項 5】**

前記シェルが外側シェルであり、前記充填材料が、治療薬を含む組成物を封入した生分解可能なポリマーを含む内側シェルを含み；選択的に前記内側シェルに封入された前記組成物が、生分解可能なポリマーを含むマイクロ粒子を含む、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 6】**

a ) シェル及び充填材料を含む第一型のマイクロカプセルであって、前記シェルが生分解可能なポリマーを含み、そして前記充填材料が治療薬を含み、そして前記シェルが前記充填材料を完全に封入する、マイクロカプセルと；

b ) シェル及び充填材料を含む第二型のマイクロカプセルであって、前記シェルが生分解可能なポリマーを含み、そして前記充填材料が治療薬を含み、そして前記シェルが前記充填材料を完全に封入する、マイクロカプセルと；

を含む、請求項 1 に記載の組成物であって、

前記第一型のマイクロカプセル及び前記第二型のマイクロカプセルが、平均Dv及び組成の一方又は両方で異なり；選択的に、前記第一型のマイクロカプセルが、患者に注射されたときに少なくとも 3 か月間の期間にわたって治療薬を放出するように調合され、そして前記第二型のマイクロカプセルが、患者に注射されたときに少なくとも 6 か月間の期間にわたって治療薬を放出するように調合される、組成物。

**【請求項 7】**

前記充填材料が、複数の第一型のマイクロ粒子を含み、但しこの場合、前記第一型の前記マイクロ粒子が生分解可能なポリマーを含み；選択的に、前記充填材料が更に第二型のマイクロ粒子を含み、但しこの場合、前記第二型の前記マイクロ粒子が生分解可能なポリマーを含む、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 8】**

前記充填材料が、第二型のマイクロ粒子を更に含み、前記第二型のマイクロ粒子が生分解可能なポリマーを含み、そして前記第一型のマイクロ粒子が治療薬を含み、そして前記第二型のマイクロ粒子が治療薬を含み、そして前記治療薬及び生分解可能なポリマーの両者が同じであっても、又は異なっていてもよく；選択的に、治療薬を含む前記第一型のマイクロ粒子が第一の治療薬放出プロファイルを有し；選択的に、前記第一型のマイクロ粒子が、それらの治療薬の 90 % を、生理的溶液又は患者に暴露してから 1 乃至 3 か月の間に放出し；選択的に、治療薬を含む前記第二型のマイクロ粒子が第二の治療薬放出プロファイルを有し；選択的に、記第二型のマイクロ粒子が、それらの治療薬の 90 % を、生理的溶液又は患者に暴露してから 3 乃至 6 か月の間に放出する、請求項 7 に記載の組成物。

**【請求項 9】**

( i ) 前記第一及び第二の治療薬が同じである；あるいは

( i i ) 前記第一及び第二の治療薬が異なる、

請求項 8 に記載の組成物。

**【請求項 10】**

前記充填材料が更に第三型のマイクロ粒子を含み、但しこの場合、前記第三型のマイクロ粒子が生分解可能なポリマーを含む、請求項 7 に記載の組成物。

**【請求項 11】**

( i ) 前記シェルが治療薬を含む；あるいは

( i i ) 前記シェルが治療薬を含まない；あるいは

( i i i ) 前記充填材料が、生分解可能なポリマーと混合していない治療薬を含む；あるいは

( i v ) 前記充填材料がポリペプチドを含む、

請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 12】**

シェル及び充填材料を含むマイクロカプセルを調製する方法であって、

少なくとも一つの空洞を有するテンプレートを提供するステップと；

生体分解可能なポリマーを含むゲル組成物の液体を少なくとも一つの空洞に塗布することにより、前記少なくとも一つの空洞の表面上に生体分解可能なポリマーを含む組成物の一層を形成するステップと；

生体分解可能なポリマーを含む前記組成物を固化させて開放したシェルを形成するステップと；

前記開放したシェルをコア材料で充填するステップと、

生体分解可能なポリマーを含む生体分解可能なポリマーを含む液体又はゲル組成物を、前記シェルの開放部に塗布して、前記生体分解可能なポリマーを含む前記液体又はゲル組成物を固化させることにより前記開放したシェルを密封することで、前記コア材料を封入したシェルを含むマイクロカプセルを形成するステップと、

前記マイクロカプセルを前記テンプレートから解放するステップとを含む、方法。

**【請求項 1 3】**

( i ) 前記テンプレートが水溶性のポリマーを含む；あるいは

( i i ) 前記テンプレートがヒドロゲルを含む；あるいは

( i i i ) 生体分解可能なポリマーを含む前記組成物が液体又はペーストである、請求項 1 2 に記載の方法。

**【請求項 1 4】**

前記シェルが、水不透過性のポリマー・メンブレン、半透過性のメンブレン、生体分解可能なポリマーを、水不透過性のポリマー・メンブレン又は水不透過性のメンブレンと組み合わせて含む、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 1 5】**

すべての治療薬が 120 日の期間内にわたって放出される、請求項 1 に記載の組成物。