

【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22年12月24日(2010.12.24)

【公表番号】特表2010-508902(P2010-508902A)  
 【公表日】平成22年3月25日(2010.3.25)  
 【年通号数】公開・登録公報2010-012  
 【出願番号】特願2009-535347(P2009-535347)  
 【国際特許分類】

A 6 1 L 27/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 L 27/00 D

【手続補正書】

【提出日】平成22年11月4日(2010.11.4)

【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】

ポリマーマトリックス、および生物活性剤のポリマーマトリックス内に組み込まれた生物活性剤を含む眼のデバイスであって、生物活性剤は、ポリマーマトリックス内に、静電相互作用、疎水性/疎水性相互作用、ポリマーマトリックスへの共有結合、またはこれらの任意の組み合わせにより固定化され、眼のデバイスは、眼の中の涙と接触するとき、1種以上の涙成分によりポリマーマトリックスから生物活性剤を放出することを誘発されることができ、眼のデバイス。

【請求項2】

ポリマーマトリックスを、化学線架橋性プレポリマーを含む流体組成物の重合により製造する、請求項1のデバイス。

【請求項3】

プレポリマーが水溶性である、請求項2のデバイス。

【請求項4】

プレポリマーが、水溶性架橋性ポリビニルアルコールプレポリマー；水溶性ビニル基末端ポリウレタン；ポリビニルアルコール、ポリエチレンイミンもしくはポリビニルアミンの誘導体；水溶性架橋性ポリ尿素プレポリマー；架橋性ポリアクリルアミド；ビニルラクタム、メタクリル酸メチルおよびモノマーの架橋性統計的コポリマー；ビニルラクタム、酢酸ビニルおよびビニルアルコールの架橋性コポリマー；架橋性側鎖を有するポリエーテル-ポリエステルコポリマー；分岐状ポリアルキレングリコール-ウレタンプレポリマー；ポリアルキレングリコール-テトラ(メタ)アクリレートプレポリマー；架橋性のポリアリルアミングルコノラクトンプレポリマー、またはこれらの任意の混合物を含む、請求項2のデバイス。

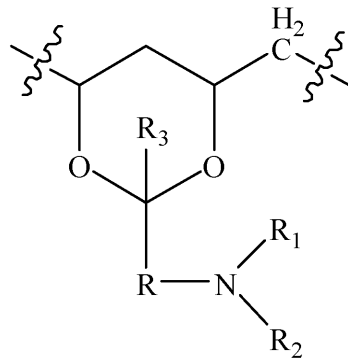
【請求項5】

プレポリマーが、シリコン含有プレポリマーを含む、請求項2のデバイス。

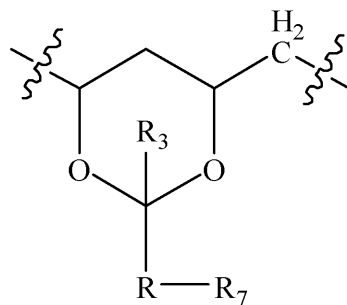
【請求項6】

プレポリマーがポリヒドロキシル化合物であり、分子量が少なくとも約2,000であり、式I~III:

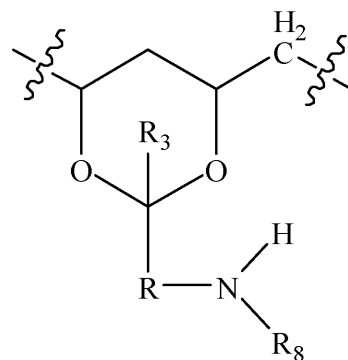
## 【化 1 2】



I



II



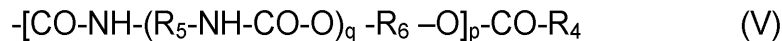
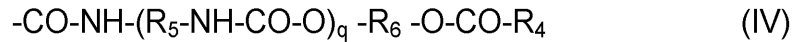
III

(式中、 $R_3$ は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基またはシクロアルキル基であり、 $R$ は、炭素原子を12個まで有する直鎖状または分岐状のアルキレン二価基であり、 $R_1$ は、水素、または炭素原子を7個まで有するアルキルであり、 $R_2$ は、炭素原子を25個まで有する、オレフィン性不飽和の、電子吸引、架橋性基であり、 $R_7$ は、式 $N^+(R')_3X^-$ (式中、各 $R'$ は、独立に、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、 $X$ は、 $HSO_4^-$ 、 $F^-$ 、 $Cl^-$ 、 $Br^-$ 、 $I^-$ 、 $CH_3COO^-$ 、 $OH^-$ 、 $BF_4^-$ 、および $H_2PO_4^-$ からなる群より選ばれた対イオンである)の第一級、第二級もしくは第三級アミノ基または第四級アミノ基であり、 $R_8$ は、一塩基、二塩基または三塩基の、飽和または不飽和の、脂肪族または芳香族の有機酸またはスルホン酸の基である。)の単位を、化合物中のヒドロキシル基の数に基づいて、約0.5~約80%含む、請求項2のデバイス。

## 【請求項7】

ポリヒドロキシル化合物が、分子量が少なくとも約2,000であり、式I[式中、 $R$ は炭素原子を6個まで有する低級アルキレン二価基であり、 $R_1$ は水素または炭素原子を7個まで有するアルキルであり、 $R_3$ は水素であり、 $R_2$ は、式(IV)または(V)]:

## 【化 1 3】



(式中、p および q は、互いに独立に、0 または 1 であり、 $\text{R}_5$  および  $\text{R}_6$  は、互いに独立に、炭素原子を 2 ~ 8 個有する低級アルキレン二価基、炭素原子を 6 ~ 12 個有するアリーレン二価基、炭素原子を 6 ~ 10 個有する飽和の二価の脂環式の基、炭素原子を 7 ~ 14 個有するアリーレンアルキレンもしくはアルキレンアリーレン二価基、または炭素原子を 13 ~ 16 個有するアリーレンアルキレンアリーレン二価基であり、 $\text{R}_4$  は、炭素原子を 2 ~ 24 個有するオレフィン性不飽和架橋性基である) の基である] の単位が、化合物中のヒドロキシル基の数に基づいて、約 0.5 ~ 約 80%、1 ~ 50%、1 ~ 25%、または 2 ~ 15% である、請求項 6 のデバイス。

## 【請求項 8】

生物活性剤およびポリマーマトリックスが、イオン基、イオン性基、またはこれらの組み合わせを少なくとも 1 種含む、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項のデバイス。

## 【請求項 9】

生物活性剤が、ドラッグ、アミノ酸、ポリペプチド、タンパク質、核酸、またはこれらの任意の組み合わせを含む、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項のデバイス。

## 【請求項 10】

生物活性剤がドラッグを含み、ドラッグがレバミピド、オラブチジン、クロモグリコラート、クロモグリク酸ナトリウム、シクロスポリン、ネドクロミル、レボカバスチン、ロドキサミド、ケトチフェン、ピメクロリムス、ヒアルロナン、またはこれらの薬学的に許容される塩もしくはエステルを含むドラッグを含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項のデバイス。

## 【請求項 11】

デバイスがさらに、ポリマーマトリックス中に組み込まれたキャリア剤を含み、キャリア剤が、イオン基、イオン性基、またはこれらの組み合わせを少なくとも 1 種含む、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項のデバイス。

## 【請求項 12】

キャリア剤が、カルボン酸基 1 個以上を含むポリマーを含む、請求項 11 のデバイス。

## 【請求項 13】

キャリア剤が、ポリアクリル酸、ポリメタクリル酸、またはポリエチレンイミンを含む、請求項 11 のデバイス。

## 【請求項 14】

眼のデバイスが、パッケージ溶液中に、長期間、パッケージ溶液中に 1 年間貯蔵後約 20% 未満浸出することにより特徴付けられる有意な程度までの浸出を伴わず保管される性能を有することを特徴とする、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項のデバイス。

## 【請求項 15】

生物活性剤が、ポリマーマトリックスから 6 時間 ~ 30 日放出される、請求項 1 のデバイス。

## 【請求項 16】

デバイスがコンタクトレンズまたは眼内レンズを含む、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項のデバイス。

## 【請求項 17】

工程：

- a. マトリックス形成材料および生物活性剤を混合し；
- b. 工程 (a) で生成した混和物をデバイス製造用型に導入し；
- c. 型内のマトリックス形成材料を重合してデバイスを形成することを含み、ここで生物

活性剤は、ポリマーマトリックスと相互作用し、マトリックス形成材料の重合中に生成したポリマーマトリックスに固定化される、眼のデバイスの製造方法。

【請求項 18】

マトリックス形成材料が化学線架橋性プレポリマーを含む、請求項17の方法。

【請求項 19】

請求項17の方法であって、該方法により製造したデバイスを抽出プロセスに付さない方法。

【請求項 20】

請求項17の方法により作られたデバイス。

【請求項 21】

対象の眼を請求項 1 のデバイスと接触させることを含み、ここで 1 種以上の涙成分が生物活性剤をデバイスから放出する、生物活性剤を対象に送達する方法。