

【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6部門第2区分

【発行日】平成28年7月14日(2016.7.14)

【公表番号】特表2015-524082(P2015-524082A)

【公表日】平成27年8月20日(2015.8.20)

【年通号数】公開・登録公報2015-052

【出願番号】特願2015-514217(P2015-514217)

【国際特許分類】

G 02 C 7/04 (2006.01)

C 08 J 7/00 (2006.01)

G 02 C 7/00 (2006.01)

【F I】

G 02 C 7/04

C 08 J 7/00 C F H A

G 02 C 7/00

【手続補正書】

【提出日】平成28年5月23日(2016.5.23)

【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】

シリコーン含有ポリマーと、

それぞれが約10～約10,000の範囲内の重合度を有する、複数の一次ポリマー鎖を含む、少なくとも1つの水溶性架橋コポリマーと、を含む、眼科用デバイスであって、前記コポリマーが、前記眼科用デバイスの少なくとも1つの表面と会合し、かつ、前記眼科用デバイスの脂質の取り込みを、前記シリコーン含有ポリマーと比較して、少なくとも約20%低減させる、眼科用デバイス。

【請求項2】

前記脂質の取り込みが、約12μg/レンズ未満、又は約10μg/レンズ以下である、請求項1に記載の眼科用デバイス。

【請求項3】

前記コポリマーが、約0.01～約3の範囲内の、橋架け剤対一次ポリマー鎖のモル比を有する、請求項1又は2に記載の眼科用デバイス。

【請求項4】

前記一次ポリマー鎖が、約50～約5,000、又は約100～約1000の範囲内の重合度を独立して有する、請求項1～3のいずれか一項に記載の眼科用デバイス。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0226

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0226】

(76) 前記コモノマーが、アニオン性モノマー、双性イオン性モノマー、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、実施態様72～75のいずれかに記載の組成物。

( 7 7 ) 前記少なくとも 1 つの水溶性架橋コポリマーが、反応基を含まない、実施態様 1 ~ 3 5 のいずれかに記載のプロセス。

( 7 8 ) 前記少なくとも 1 つの水溶性架橋コポリマーが、反応基を含まない、実施態様 2 0 ~ 3 0 のいずれかに記載の組成物。

( 7 9 ) 前記少なくとも 1 つの水溶性架橋コポリマーが、末端会合性セグメントを含まない、実施態様 3 7 ~ 4 1 のいずれかに記載の眼科用デバイス。

( 8 0 ) 前記少なくとも 1 つの水溶性架橋コポリマーが、末端会合性セグメントを含まない、実施態様 4 2 ~ 4 7 のいずれかに記載の点眼剤。

( A 1 ) コンタクトレンズを、脂質の取り込みを低減させる量の少なくとも 1 つの水溶性架橋コポリマーを含む溶液に、前記コポリマーを前記コンタクトレンズに会合させるのに好適な接触条件下で、接触させることを含むプロセスであって、前記架橋コポリマーは、それぞれが約 1 0 ~ 約 1 0 , 0 0 0 の範囲内の重合度を有している、複数の架橋一次ポリマー鎖を含み、前記架橋コポリマーは、ポリマー骨格に直接結合したカルボン酸基を含む反復単位を含まない、プロセス。

( A 2 ) 前記コンタクトレンズが、シリコーンヒドロゲルコンタクトレンズを含む、実施態様 A 1 に記載のプロセス。

( A 3 ) 前記水溶性架橋コポリマーが、約 0 . 0 1 ~ 約 3 の範囲内の、橋架け剤対一次ポリマー鎖のモル比を有する、実施態様 A 1 又は A 2 に記載のプロセス。

( A 4 ) 前記脂質の取り込みを低減させる量が、少なくとも約 1 0 p p m 、又は約 1 0 p p m ~ 約 1 0 , 0 0 0 p p m である、実施態様 A 1 ~ A 3 のいずれかに記載のプロセス。

( A 5 ) 前記レンズによる脂質の取り込みが、約 1 0 μ g / レンズ以下である、実施態様 A 1 ~ A 4 のいずれかに記載のプロセス。

( A 6 ) 前記一次ポリマー鎖が、親水性ポリマー及びコポリマー、プロトン供与性ポリマー及びコポリマー、プロトン受容性ポリマー及びコポリマー、イオン性ポリマー及びコポリマー、錯体生成ポリマー及びコポリマー、刺激応答性ポリマー及びコポリマー、並びにこれらの混合物からなる群から選択される、実施態様 A 1 ~ A 5 のいずれかに記載のプロセス。

( A 7 ) 前記プロトン供与性ポリマー及びコポリマーが、1 つ又は 2 つ以上のアルコールを含むか、又は、

前記プロトン受容性ポリマー及びコポリマーが、1 つ又は 2 つ以上のアミドを含むか、又は、

前記イオン性ポリマー及びコポリマーが、カルボキシレート、スルホネート、アンモニウム塩、及びホスホニウム塩のうちの 1 つ又は 2 つ以上を含むか、又は、

前記錯体生成ポリマー及びコポリマーが、1 つ又は 2 つ以上のボロン酸官能基及び / 又はヒドロキシル官能基を含むか、又は、

前記刺激応答性ポリマー及びコポリマーが、温度応答性ポリマー、p H 応答性ポリマー、電解質応答性ポリマー、光応答性ポリマー、及びこれらの混合物からなる群から選択されるポリマーを含む、実施態様 A 6 に記載のプロセス。

( A 8 ) 前記温度応答性ポリマーが、ポリ ( N - イソプロピルアクリルアミド ) である、実施態様 A 7 に記載のプロセス。

( A 9 ) 前記コポリマーが、親水性及びプロトン供与性の両方である、実施態様 A 7 又は A 8 に記載のプロセス。

( A 1 0 ) 前記コポリマーが、N - ビニルピロリドン、N , N - ジメチルアクリルアミド、及び N - ヒドロキシプロピルメタクリルアミドからなる群から選択される少なくとも 1 つのモノマーの重合に由来する反復単位を含む、実施態様 A 9 に記載のプロセス。

( A 1 1 ) 前記コポリマーが、ビニルアミド、ビニルラクトン、ビニルイミド、ビニルラクタム、親水性 ( メタ ) アクリレート、( メタ ) アクリルアミド、及びこれらの混合物からなる群から選択されるモノマーから形成される、実施態様 A 1 ~ A 1 0 のいずれかに記載のプロセス。

(A 12) 前記一次ポリマー鎖が、N,N'-アルキレンビス(メタ)アクリルアミド、ポリアルキレングリコールジ(メタ)アクリレート、ポリアルキレングリコールジ(メタ)アクリルアミド、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される少なくとも1つの架橋剤によって架橋される、実施態様A 1～A 11のいずれかに記載のプロセス。

(A 13) 前記コポリマーが、置換又は非置換のアクリル酸に由来する反復単位を含まない、実施態様A 1～A 12のいずれかに記載のプロセス。

(A 14) 1つ又は2つ以上の架橋コポリマーを含む親水性ナノゲル材料を含む組成物であって、前記コポリマーが、約10～約10,000の範囲内の重合度を有する1つ又は2つ以上の一次ポリマー鎖を含み、かつ前記親水性ナノゲル材料が、(a)表面と会合し、かつ(b)末端基材会合性セグメントを含まない、組成物。

(A 15) 前記一次ポリマー鎖が、約50～約5,000、約100～約1000、約100～約500、又は約100～約300の範囲内の重合度を独立して有する、実施態様A 14に記載の組成物。

(A 16) 前記親水性ナノゲルが、約0.01～約3の範囲内の、橋かけ剤対一次ポリマー鎖のモル比を有する、実施態様A 15に記載の組成物。

(A 17) 前記一次ポリマー鎖が、約1.5未満の多分散指数(PDI)を有する前記親水性ナノゲルの他の一次ポリマー鎖に架橋される、実施態様A 15又はA 16に記載の組成物。

(A 18) 前記一次ポリマー鎖が、共有結合、イオン結合、水素結合、又はこれらの組み合わせによって架橋される、実施態様A 16に記載の組成物。

(A 19) 前記一次ポリマー鎖が、親水性ポリマー及びコポリマー、プロトン供与性ポリマー及びコポリマー、プロトン受容性ポリマー及びコポリマー、イオン性ポリマー及びコポリマー、錯体生成ポリマー及びコポリマー、刺激応答性ポリマー及びコポリマー、並びにこれらの混合物からなる群から選択される、実施態様A 15～A 18のいずれかに記載の組成物。

(A 20) 前記一次ポリマー鎖が、ビニルアミド、ビニルラクトン、ビニルイミド、ビニルラクタム、親水性(メタ)アクリレート、(メタ)アクリルアミド、及びこれらの混合物からなる群から選択されるモノマーから形成される、実施態様A 15～A 19のいずれかに記載の組成物。

(A 21) 前記一次ポリマー鎖が、N,N'-アルキレンビス(メタ)アクリルアミド、ポリアルキレングリコールジ(メタ)アクリレート、ポリアルキレングリコールジ(メタ)アクリルアミド、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される少なくとも1つの架橋剤によって架橋される、実施態様A 15～A 20のいずれかに記載の組成物。

(A 22) 前記表面が、前記親水性ナノゲル材料で前記表面が処理された後に約50°以下の接触角を備えるシリコーンヒドロゲルである、実施態様A 15～A 21のいずれかに記載の組成物。

(A 23) プロセスであって、

(a) 少なくとも1つの親水性成分と、それぞれが約10～約10,000の範囲内の重合度を有している複数の一次ポリマー鎖を含む少なくとも1つの水溶性架橋コポリマーと、を含む、反応混合物を形成することと、

(b) 前記反応混合物を硬化させて、コンタクトレンズを形成することと、  
を含む、プロセス。

(A 24) 前記反応混合物が、少なくとも1つのシリコーン含有成分を更に含む、実施態様A 23に記載のプロセス。

(A 25) 前記反応混合物が、約0.1～約50重量%、1～約20重量%、又は約2～約15重量%の前記コポリマーを含む、実施態様A 23又はA 24に記載のプロセス。

(A 26) シリコーン含有ポリマーと、

それぞれが約10～約10,000の範囲内の重合度を有する、複数の一次ポリマー鎖を含む、少なくとも1つの水溶性架橋コポリマーと、を含む、眼科用デバイスであって、前記コポリマーが、前記眼科用デバイスの少なくとも1つの表面と会合し、かつ、前記眼

科用デバイスの脂質の取り込みを、前記シリコーン含有ポリマーと比較して、少なくとも約20%低減させる、眼科用デバイス。

(A27) 前記脂質の取り込みが、約12μg/レンズ未満、又は約10μg/レンズ以下である、実施態様A26に記載の眼科用デバイス。

(A28) 前記コポリマーが、約0.01~約3の範囲内の、橋架け剤対一次ポリマー鎖のモル比を有する、実施態様A26又はA27に記載の眼科用デバイス。

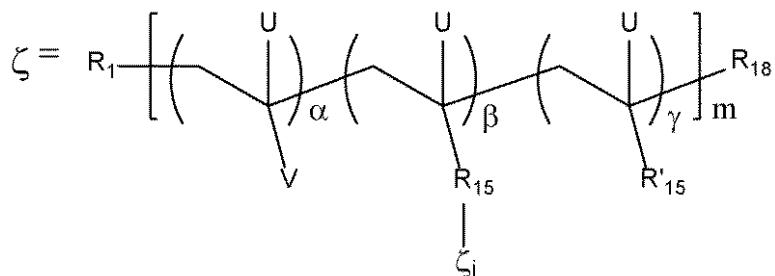
(A29) 前記一次ポリマー鎖が、約50~約5,000、又は約100~約1000の範囲内の重合度を独立して有する、実施態様A26~A28のいずれかに記載の眼科用デバイス。

(A30) それぞれが約10~約10,000、約50~約1,000、又は約100~約500の範囲内の重合度を有する複数の一次ポリマー鎖を含む少なくとも1つの水溶性架橋コポリマーを含む点眼剤であって、前記コポリマーが、前記点眼剤に浸したコンタクトレンズ内の脂質の取り込みを抑制するのに有効な量で存在し、かつ前記点眼剤が、透明である、点眼剤。

(A31) 前記コポリマーが、約0.01~約3の範囲内の、橋架け剤対一次鎖のモル比を有する、実施態様A30に記載の点眼剤。

(A32) 前記少なくとも1つのコポリマーが、約0.005~約2重量%、又は約0.01~約0.5重量%の範囲内の量で存在する、実施態様A30又はA31に記載の点眼剤。

(A33) 次の式が表す一次鎖を有する水溶性架橋ポリマーを含む組成物であって、  
【化21】



式中、R<sub>1</sub>は、任意に置換されたアルキレン、任意に置換された飽和、不飽和、又は芳香族炭素環若しくは複素環、任意に置換されたアルキルチオ、任意に置換されたアルコキシ、又は任意に置換されたジアルキルアミノからなる群から選択される二価基であり、

Uは、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルからなる群から独立して選択され、前記C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルは、ヒドロキシル、アルコキシ、アリールオキシ(OR')、カルボキシ、アシルオキシ、アロイルオキシ(O, CR')、アルコキシ-カルボニル、アリールオキシ-カルボニル(CO, R')及びこれらの組み合わせで任意に置換されてよく、

Vは、R'、-CO<sub>2</sub>R'、-COR'、-CN、-CONH<sub>2</sub>、-CONHR'、-CONR'、-O<sub>2</sub>CR'、-OR'、環式及び非環式N-ビニルアミド、及びこれらの組み合わせからなる群から独立して選択され、

R'は、任意に置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>18</sub>アルケニル、アリール、ヘテロシクリル、アルカリルからなる群から独立して選択され、ここで、該置換基は、エポキシ、ヒドロキシル、アルコキシ、アシル、アシルオキシ、カルボキシ、カルボキシレート、スルホン酸、及びスルホネート、アルコキシ-若しくはアリールオキシ-カルボニル、イソシアネート、シアノ、シリル、ハロ、ジアルキルアミノ、リン酸、ホスフェート、ホスホン酸、ホスホネート、及びこれらの組み合わせからなる群から独立して選択され、

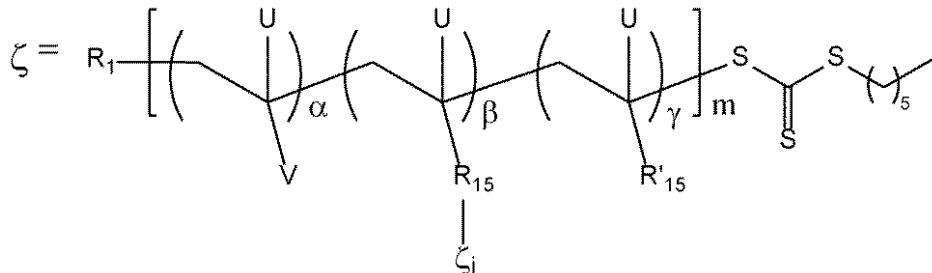
R<sub>15</sub>'及びR<sub>15</sub>は、親水性フリーラジカル反応性架橋剤の残基であり、

R<sub>18</sub>は、制御ラジカル重合剤であり、

は、別の一次鎖であり、モル分率であり、は、約0.85~約0.999と等し

く、は、0ではなく、ととを合わせたモル分率は、約0.15～約0.001である、組成物。

(A34) 次の式が表す一次鎖を有する水溶性架橋ポリマーを含む組成物であって、  
【化22】



$R_1$ 、U、V、 $R_{15}$ 、 $R'_{15}$ 、 $\zeta_i$ 及びmが、実施態様A33に定義の通りである、組成物。

(A35)  $R_1$ が、任意に置換されたベンジル、任意に置換されたフェニル、エタノエート(ethanoate)、任意に置換されたプロピオネート、4-シアノペンタノエート、又はイソブチレート(isobutyroate)官能基からなる群から選択される、実施態様A33又はA34に記載の組成物。

(A36)  $R_1$ が、4-シアノペンタノエート、イソブタン(isobutanoic)基、又はベンジル基からなる群から選択されるか、又は、シアノメチル基又はクミル基からなる群から選択されるか、又は、多価である、実施態様A33又はA34に記載の組成物。

(A37) Uが、H又はメチルから選択される、実施態様A33～A36のいずれかに記載の組成物。

(A38)  $R'$ が、メチル、-CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C<sub>H</sub>H<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O<sub>H</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-SO<sub>3</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-SO<sub>3</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-SO<sub>3</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-SO<sub>3</sub>-、-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>-、-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-SO<sub>3</sub>H、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-SO<sub>3</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-PO<sub>3</sub><sup>-2</sup>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-PO<sub>3</sub><sup>-2</sup>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-PO<sub>3</sub><sup>-2</sup>、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、実施態様A33～A36のいずれかに記載の組成物。

(A39) Vが、ピロリドニル、ピペリドニル、2-カプロラクタム、3-メチル-2-カプロラクタム、3-メチル-2-ピペリドニル、4-メチル-2-ピペリドニル、4-メチル-2-カプロラクタム、3-エチル-2-ピロリドニル、4,5-ジメチル-2-ピロリドニル、イミダゾリル、N-N-ジメチルアミド、アミド、N,N-ビス(2-ヒドロキシエチル)アミド、-シアノ、N-イソプロピルアミド、アセテート、カルボキシポリエレングリコール、N-(2-ヒドロキシプロビル)アミド、N-(2-ヒドロキシエチル)アミド、カルボキシエチルホスホリルコリン、3-(ジメチル(4-ベンジル)アンモニオ)プロパン-1-スルホネート3-((3-アミドプロピル)ジメチルアンモニオ)プロパン-1-スルホネート3-((3-(カルボキシ)プロピル)ジメチルアンモニオ)プロパン-1-スルホネートN-メチルアセトアミド、-アセトアミド、N-メチルプロピオニアミド、N-メチル-2-メチルプロピオニアミド、2-メチルプロピオニアミド、N,N'-ジメチル尿素等、及びこれらの混合物からなる群から選択される、実施態様A37に記載の組成物。

(A 4 0) Vが、-N-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、ピロリドニル、-CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、N-(2-ヒドロキシエチル)アミド、又は-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>からなる群から選択される、実施態様A 3 7又はA 3 9に記載の組成物。

(A 4 1) R<sub>15</sub>及びR<sub>15'</sub>架橋剤が、ジメチルシロキサン基を含まない、実施態様A 3 3～A 4 0のいずれかに記載の組成物。

(A 4 2) R<sub>15</sub>及びR<sub>15'</sub>が、アルキレンが1～12個の炭素を有する、N,N'-アルキレンビス(メタ)アクリルアミド、ポリアルキレングリコールジ(メタ)アクリレート、ポリアルキレングリコールジ(メタ)アクリルアミド、トリアリルシアヌレート、1,3-ジビニルイミダゾリジン-2-オン、及び3,3'アルキレンビス(1-ビニルピロリジン-2-オン)、及びこれらの混合物からなる群から選択される、少なくとも1つの架橋剤の重合残基である、実施態様A 3 3～A 4 1のいずれかに記載の組成物。

(A 4 3) R<sub>15</sub>及びR<sub>15'</sub>が、N,N'-メチレンビス(メタ)アクリルアミド、N,N'-エチレンビス(メタ)アクリルアミド、N,N'-プロピレンビス(メタ)アクリルアミド、N,N'-ブチレンビス(メタ)アクリルアミド、N,N'-ペンタメチレンビス(メタ)アクリルアミド、N,N'-ヘキサメチレンビス(メタ)アクリルアミド、エチレングリコールジ(メタ)アクリレート、トリエチレングリコールジ(メタ)アクリレート、テトラ-エチレングリコールジ(メタ)アクリレート、N,N'-(オキシビス(エタン-2,1-ジイル))ジアクリルアミドN,N'-(((オキシビス(エタン-2,1-ジイル))ビス(オキシ))ビス(エタン-2,1-ジイル))ジアクリルアミド、トリアリルシアヌレート、1,3-ジビニルイミダゾリジン-2-オン、及びこれらの混合物からなる群から選択される、少なくとも1つの架橋剤の重合残基である、実施態様A 3 3～A 4 2のいずれかに記載の組成物。

(A 4 4) R<sub>18</sub>が、RAFT、TERP、NMP、又はATRP制御剤である、実施態様A 3 3～A 4 3のいずれかに記載の組成物。

(A 4 5) が、約0.92～約0.999、約0.95～約0.999、又は約0.97～約0.999であり、かつ前記ととを合わせたモル分率が、約0.08～約0.001、約0.05～約0.001、又は約0.025～約0.001である、実施態様A 3 3～A 4 4のいずれかに記載の組成物。

(A 4 6) 前記水溶性架橋ポリマーが、約25～約5,000、約100～約1000、約100～約500、又は約100～約300の範囲内の重合度を有する、実施態様A 3 3～A 4 4のいずれかに記載の組成物。

(A 4 7) 前記水溶性架橋ポリマーが、基材会合性ブロックを含まない、実施態様A 3 3～A 4 6のいずれかに記載の組成物。

(A 4 8) 前記一次鎖が、約1.5未満のPDIを有する、実施態様A 3 3～A 4 7のいずれかに記載の組成物。

(A 4 9) Vの少なくとも約20%が、N-(2-ヒドロキシプロピル)(メタ)アクリルアミドに由来する、実施態様A 3 3～A 4 8のいずれかに記載の組成物。

(A 5 0) Vが、コモノマーに由来する反復単位を含む、実施態様A 3 3～A 4 9のいずれかに記載の組成物。

(A 5 1) Vが、アニオン性基を含まない、実施態様A 3 3に記載の組成物。

(A 5 2) 前記コモノマーが、親水性モノマー、疎水性モノマー、アニオン性モノマー、カチオン性モノマー、双性イオン性モノマー、刺激応答性モノマー、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、実施態様A 5 0又はA 5 1に記載の組成物。

(A 5 3) 前記コモノマーが、アニオン性モノマー、双性イオン性モノマー、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、実施態様A 5 0～A 5 2のいずれかに記載の組成物。

(A 5 4) 前記少なくとも1つの水溶性架橋コポリマーが、反応基を含まない、実施態様A 1～A 1 3のいずれかに記載のプロセス。

(A 5 5) 前記少なくとも1つの水溶性架橋コポリマーが、反応基を含まない、実施態様A 1 4～A 2 2のいずれかに記載の組成物。

(A 5 6) 前記少なくとも 1 つの水溶性架橋コポリマーが、末端会合性セグメントを含まない、実施態様 A 2 6 ~ A 2 9 のいずれかに記載の眼科用デバイス。

(A 5 7) 前記少なくとも 1 つの水溶性架橋コポリマーが、末端会合性セグメントを含まない、実施態様 A 3 0 ~ A 3 2 のいずれかに記載の点眼剤。