

【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27年3月26日 (2015.3.26)

【公表番号】特表2014-513094(P2014-513094A)

【公表日】平成26年5月29日 (2014.5.29)

【年通号数】公開・登録公報2014-028

【出願番号】特願2014-508441(P2014-508441)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 23/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/255 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 23/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 31/255

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/26

【手続補正書】

【提出日】平成27年2月3日(2015.2.3)

【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】

可溶化親油性医薬用薬剤および両親媒性液体ポリマー溶媒を含む非水性の均一な溶液であって、製剤が非ポリマー有機溶媒、水および非可溶化粒子を本質的に含有せず、前記可溶化親油性医薬用薬剤が少なくとも約 0.5 mg/mL の濃度を有し、さらに前記溶液が室温保存したときに少なくとも40日の間は安定で、非可溶化粒子を本質的に含有しない溶液。

【請求項 2】

室温保存したときに少なくとも60日の間は安定で、非可溶化粒子を本質的に含有しない、請求項 1 に記載の非水性の均一な溶液。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の溶液を得るステップ、および前記溶液を所望の水性希釈剤で希釈するステップを含む方法によって調製される、水性の均一な薬学的に許容される非経口製剤。

【請求項 4】

前記可溶化親油性医薬用薬剤が、約 $1 \sim 10 \text{ mg/mL}$ の濃度を有する、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 5】

前記可溶化親油性医薬用薬剤が、約 $3 \sim 9 \text{ mg/mL}$ の濃度を有する、請求項 4 に記載の溶液。

【請求項 6】

前記親油性医薬用薬剤が、7-メトキシブテリジン、7-メチルブテリジン、アバカビル、アバフンジン、アバレリックス、アセプトロール、アセナフテン、アセトアミノフェン、アセトアニリド、アセタゾラミド、アセトヘキサミド、アセトレチン、アクリバステイン、アデニン、アデノシン、アラトロフロキサシン、アルベンダゾール、アルブテロール、アルクロフェナック、アルデスロイキン、アレムツズマブ、アルフゾシン、アリトレチノイン、アロバルピタール、アロピュリノール、オールトランスレチノイン酸(ATRA)、アロキシプリン、アルブラゾラム、アルプレノロール、アルトレタミン、アミホスチン、アミロライド、アミノグルテチミド、アミノピリン、アミオダロンHC1、アミトリプチリン、アムロジピン、アモバルピタール、アモジアキン、アモキサピン、アンフェタミン、アンホテリシン、アンホテリシンB、アンピシリン、アンブレナビル、アムサクリン、アミルニトレート、アミロバルピトン、アナストロゾール、アンリノン、アントラセン、アントラサイクリン、アプロバルピタール、三酸化ヒ素、アスパラギナーゼ、アスピリン、アステミゾール、アテノロール、アトルバスタチン、アトバクオン、アトラジン、アトロピン、アザチオプリン、オーラノフィン、アザシチジン、アザプロバゾン、アザチオプリン、アジンタミド、アジスロマイシン、アズトレオヌム、バクロフェン、バルピトン、BCG生、ベクラミド、ベクロメタゾン、ベンドロフルメチアジド、ベネゼプリル、ベニジピン、ベノリレート、ベンペリドール、ベントゼパム、ベンズアミド、ベンズアントラセン、ベンザチンベニシリン、ベンズヘキサールHC1、ベンズニダゾール、ベンゾジアゼピン、安息香酸、ベフェニウムヒドロキシナフトエート、ベタメタゾン、ベバシズマブ(アバステチン)、ベキサロテン、ベザフィブラート、ピカルタミド、ピフォナゾール

、ビペリデン、ビスコジル、ビスアントレン、プレオマイシン、プレオマイシン、ボルテゾミブ、プリンゾールアミド、プロマゼパム、メシル酸プロモクリブチン、プロムペリドール、プロチゾラム、ブデソニド、ブメタニド、ブプロピオン、ブスルファン、ブタルピタール、ブタンベン、ブテナフィンHCl、ブトバルピトン（ブテタール）、ブトコナゾール、硝酸ブトコナゾール、ブチルパラベン、カフェイン、カルシフェジオール、カルシプロトリエン、カルシトリオール、カルステロン、カンベンダゾール、樟脳、カンプトセシン、カンプトセシン類似体、カンデサルタン、カベシタビン、カブサイシン、カプトブリル、カルバマゼピン、カルビマゾール、カルボフラン、カルボブラチン、カルプロマール、カリマゾール、カルムスチン、セファマンドール、セファゾリン、セフィキシム、セフトジジム、セフロキシムアキセチル、セレコキシブ、セフラジン、セリバスタチン、セトリジン、セツキシマブ、クロラムブシル、クロラムフェニコール、クロルジアゼボキシド、クロルメチアゾール、クロロキン、クロロチアジド、クロルフェニラミン、クロルプログアニルHCl、クロルプロマジン、クロルプロパミド、クロルプロチキセン、クロルピリホス、クロルテトラサイクリン、クロロサリドン、クロルゾキサゾン、コレカルシフェロール、クリセン、シロスタゾール、シメチジン、シンナリジン、シノキサシン、シプロフィブラート、シプロフロキサシンHCl、シサブリド、シスプラチン、シタロプラム、クラドリビン、クラリスロマイシン、フマル酸クレマスチン、クリオキノール、クロバザム、クロファラビン、クロファジミン、クロフィブラート、クエン酸クロミフェン、クロミブラミン、クロナゼパム、クロビドグレル、クロチアゼパム、クロトリマゾール、クロキサシリン、クロザピン、コカイン、コデイン、コルヒチン、コリスチン、抱合エストロゲン（conjugate oestrogen）、コルチコステロン、コルチゾン、酢酸コルチゾン、シクリジン、シクロバルピタール、シクロベンザプリン、シクロブタン・スピロバルピツレート、シクロエタン・スピロバルピツレート、シクロヘブタン・スピロバルピツレート、シクロヘキサン・スピロバルピツレート、シクロペンタン・スピロバルピツレート、シクロホスファミド、シクロプロパン・スピロバルピツレート、シクロセリン、シクロスポリン、シプロヘブタジン、シプロヘブタジンHCl、シタラビン、シトシン、ダカルバジン、ダクチノマイシン、ダナゾール、ダントロン、ダントロレンナトリウム、ダブソン、ダーベポエチン、ダロジピン、ダウノルビシン、デコキナート、デヒドロエピアンドロステロン、デラビルジン、デメクロサイクリン、デニロイキン、デオキシコルチコステロン、デソキシメタゾン、デキサメタゾン、デクスアンフェタミン、デクスクロルフェニラミン、デクスフェンフルラミン、デクスラゾキサン、デキストロプロボキシフェン、ジアモルフィン、ジアトリゾ酸、ジアゼパム、ジアゾキシド、ジクロロフェン、ジクロルプロップ、ジクロフェナク、ジクマロール、ジダノシン、ジフルニサル、ジギトキシン、ジゴキシン、ジヒドロコデイン、ジヒドロエキリン、メシル酸ジヒドロエルゴタミン、ジヨードヒドロキシキノリン、ジルチアゼムHCl、ジロキサニドフロエート、ジメンヒドリナート、ジモルホラミン、ジニトルミド、ジオスゲニン、ジフェノキシレートHCl、ジフェニル、ジピリダモール、ジリスロマイシン、ジソピラミド、ジスルフィラム、ジウロン、ドセタキセル、ドンペリドン、ドネベジル、ドキサゾシン、ドキサゾシンHCl、ドキシソルビシン（中性）、ドキシソルビシンHCl、ドキシサイクリン、プロピオン酸ドロモスタノロン、ドロペリドール、ダイフィリン、エキノカンジン、エコナゾール、硝酸エコナゾール、エファビレンツ、エリブチシン、エナラブリル、エンリモマブ、エノキシモン、エピネフリン、エピボドフィロトキシン誘導体、エピルビシン、エポエチンアルファ、エポサルタン、エキレニン、エキリン、エルゴカルシフェロール、酒石酸エルゴタミン、エルロチニブ、エリスロマイシン、エストラジオール、エストラムスチン、エストリオール、エストロン、エタクリン酸、エタンブトール、エチナメート、エチオナミド、エトプロパジンHCl、エチル-4-アミノベンゾエート（ベンゾカイン）、エチルパラベン、エチニルエストラジオール、エトドラク、エトミデート、エトボシド、エトレチナート、エクセメスタン、フェルバマート、フェロジピン、フェンベンダゾール、フェンブコナゾール、フェンブフェン、フェンクロルホス、フェンクロフェナック、フェンフルラミン、フェノフィブレート、フェノルデパム、フェノプロフェンカルシウム、フェ

ノキシカルブ、フェンピクロニル、フェンタニル、フェンチコナゾール、フェキソフェナジン、フィルグラスチム、フィナステリド、酢酸フレカミド、フロクシウリジン、フルダラビン、フルコナゾール、フルシトシン、フルジオキシニル、フルドロコルチゾン、酢酸フルドロコルチゾン、フルフェナム酸、フルナニゾン、フルナリジンHCl、フルニソリド、フルニトラゼパム、フルオコルトロン、フルオメツロン、フルオレン、フルオロウラシル、フルオキセチンHCl、フルオキシメステロン、デカン酸フルペンチキソール、フルラゼパム、フルルビプロフェン、プロピオン酸フルチカゾン、フルバスタチン、葉酸、ホセノプリル、ホスフェニトインナトリウム、フロバトリブタン、フルセミド、フルベストラント、フラゾリドン、ガバペンチン、G-BHC（リンダン）、ゲフィチニブ、ゲムシタビン、ゲムフィプロジル、ゲムツズマブ、グラフェニン、グリベンクラミド、グリクラジド、グリメピリド、グリピジド、グルテチミド、グリブリド、グリセリルトリニトレート（ニトログリセリン）、酢酸ゴセレリン、グレバフロキサシン、グリセオフルビン、グアイフェネシン、酢酸グアナベンズ、グアニン、ハロファントリンHCl、ハロペリドール、ヒドロクロロチアジド、ヘプタバルピタール、ヘロイン、ヘスペレチン、ヘキサクロロベンゼン、ヘキセタール、酢酸ヒストレリン、ヒドロコルチゾン、ヒドロフルメサイアザイド、ヒドロキシ尿素、ヒヨスチアミン、ヒポキサンチン、イブリツモマブ、イブuproフェン、イダルビシン、イドブタール、イホスファミド、イヒドロエキレニン、メシル酸イマチニブ、イミペネム、インダパミド、インジナビル、インドメタシン、インドプロフェン、インターフェロン - 2 a、インターフェロン - 2 b、ヨーダミド、ヨーバン酸、イブuproジオン、イルベサルタン、イリノテカン、イサブコナゾール、イソカルボキサジド、イソコナゾール、イソグアニン、イソニアジド、イソプロピルバルピツレート、イソプロチュロン、二硝酸イソソルビド、一硝酸イソソルビド、イスラジピン、イトラコナゾール、イトラコナゾール、イトラコナゾール（I t r a）、イベルメクチン、ケトコナゾール、ケトコナゾール、ケトプロフェン、ケトロラク、ケーリン、ラベタロール、ラミブジン、ラモトリジン、ラナトシドC、ラノスブラゾール、L-DOPA、レフルノミド、レナリドマイド、レトロゾール、ロイコボリン、酢酸ロイブproリド、レバミゾール、レボフロキサシン、リドカイン、リニユロン、リシノプリル、ロメフロキサシン、ロムスチン、ロペラミド、ロラタジン、ロラゼパム、ロレフロキサシン、ロルメタゼパム、メシル酸ロサルタン、ロバスタチン、マレイン酸リスリド、マプロチリンHCl、マジンドール、メベンダゾール、メクリジンHCl、メクロフェナム酸、メダゼパム、メジゴキシン、酢酸メドロキシプロゲステロン、メフェナム酸、メフロキンHCl、酢酸メゲストロール、メルファラン、臭化メペンゾラート、メプロバメート、メブタジノール、メルカプトプリン、メサラジン、メスナ、メソリダジン、メストラノール、メサドン、メタカロン、メトカルバモール、メトイン、メトトレキセート、メトキサレン、メトスクシミド、メチクロチアジド、メチルフェニデート、メチルフェノバルピトン、メチル-p-ヒドロキシベンゾエート、メチルプレドニゾロン、メチルテストステロン、メチプリロン、マレイン酸メチセルジド、メトクロプラミド、メトラゾン、メトプロロール、メトロニダゾール、ミアンセリンHCl、ミコナゾール、ミダゾラム、ミフェプリストーン、ミグリトール、ミノサイクリン、ミノキシジル、マイトマイシンC、ミトタン、ミトキサントロン、モフェチルマイコフェノレート、モリンドン、モンテルカスト、モルヒネ、モキシフロキサシンHCl、ナブメトン、ナドロール、ナルブフィン、ナリジクス酸、ナンドロロン、ナフタセン、ナフタレン、ナプロキセン、ナラトリブタンHCl、ナタマイシン、ナタマイシン、ネララビン、ネルフィナビル、ネビラビン、ニカルジピンHCl、ニコチンアミド、ニコチン酸、ニクマロン、ニフェジピン、ニルタミド、ニモジピン、ニモラゾール、ニソルジピン、ニトラゼパム、ニトロフラントイン、ニトロフラゾン、ニザチジン、ノフェツモマブ、ノルエチステロン、ノルフロキサシン、ノルゲストレル、ノルトリブチリンHCl、ナイスタチン、エストラジオール、オフロキサシン、オランザピン、オメブラゾール、オモコナゾール、オンダンセトロンHCl、オブレルベキン、オルニダゾール、オキサリプラチン、オキサムニキン、オキサントレムボネート、オキサプロジン、オキサトミド、オキサゼパム、オクスカルバゼピン、オクスフェンダゾール、オキシコナゾール、オクス

ブレノロール、オキシフェンブタゾン、オキシフェンサイクリミンH C 1、パクリタキセル、パリフェルミン、パミドロン酸、p - アミノサリチル酸、パントブラゾール、パラメタジオン、パロキセチンH C 1、ペガデマーズ、ペガスバルガーゼ、ペグフィルグラスチム、ペメトレキセドニナトリウム、ペニシラミン、四硝酸ペンタエリスリトール、ペンタゾシン、ペントバルビタール、ペントバルビトン、ペントスタチン、ペントキシフィリン、ペルフェナジン、ペルフェナジンピモジド、ペリレン、フェナセミド、フェナセチン、フェナントレン、フェニンジオン、フェノバルビタール、フェノールバルビトン、フェノールフタレイン、フェノキシベンザミン、フェノキシベンザミンH C 1、フェノキシメチルペニシリン、フェンスクシミド、フェニルブタゾン、フェニトイン、ピンドロール、ピオグリタゾン、ピボプロマン、ピロキシカム、マレイン酸ピゾチフェン、白金化合物、プリカマイシン、ポリエン、ポリミキシンB、ポルフィマーナトリウム、ポサコナゾール (P o s a)、プラミベキソール、プラステロン、プラバスタチン、ブラジカンテル、ブラゾシン、ブラゾシンH C 1、プレドニソロン、プレドニゾン、プリミドン、プロバルビタール、プロベネシド、プロブコール、プロカルバジン、プロクロルペラジン、プロゲステロン、プログアニルH C 1、プロメタジン、プロボフォール、プロボクスル、プロブラノロール、プロピルパラベン、プロピルチオウラシル、プロスタグランジン、プソイドエフェドリン、プテリジン - 2 - メチル - チオール、プテリジン - 2 - チオール、プテリジン - 4 - メチル - チオール、プテリジン - 4 - チオール、プテリジン - 7 - メチル - チオール、プテリジン - 7 - チオール、ピランテルエンボネート、ピラジナミド、ピレン、ピリドスチグミン、ピリメタミン、クエチアピン、キナクリン、キナプリル、キニジン、硫酸キニジン、キニーネ、硫酸キニン、ラベブラゾールナトリウム、ラニチジンH C 1、ラスブリケース、ラブコナゾール、レバグリニド、レボサル、レセルピン、レチノイド、リファブチン、リファンピシン、リファペンチン、リメキシロン、リスペリドン、リトナビル、リツキシマブ、安息香酸リザトリブタン、ロフェコキシブ、ロビニロールH C 1、ロシグリタゾン、サッカリン、サルブタモール、サリチルアミド、サリチル酸、サキナビル、サルグラモスチム、セクブタバルビタール、セコバルビタール、セルタコナゾール、セルチンドール、セルトラリンH C 1、シンバスタチン、シロリムス、ソラフェニブ、スパルフロキサシン、スピラマイシン、スピロノラクトン、スタノローン、スタノゾロール、スタブジン、スチルベストロール、ストレプトゾシン、ストリキニーネ、スルコナゾール、硝酸スルコナゾール、スルファセタミド、スルファジアジン、スルファメラジン、スルファメタジン、スルファメトキサゾール、スルファニルアミド、スルファチアゾール、スリンダク、スルファベンズアミド、スルファセタミド、スルファジアジン、スルファドキシシン、スルファフラゾール、スルファメラジン、スルファメトキサゾール、スルファピリジン、スルファサラジン、スルフィンピラゾン、スルピリド、スルチアム、コハク酸スマトリブタン、マレイン酸スニチニブ、タクリン、タクロリムス、タルブタール、クエン酸タモキシフェン、タムロシン、タルグレチン、タキサン、タザロテン、テルミサルタン、テマゼパム、テモゾロマイド、テニボシド、テノキシカム、テラゾシン、テラゾシンH C 1、テルビナフィンH C 1、硫酸テルブタリン、テルコナゾール、テルフェナジン、テストラクトン、テストステロン、テトラサイクリン、テトラヒドロカンナビノール、テトロキソプリム、サリドマイド、テバイン、テオブロミン、テオフィリン、チアベンダゾール、チアンフェニコール、チオグアニン、チオリダジン、チオテバ、トトイン、チミン、チアガピンH C 1、チボロン、チクロピジン、チニダゾール、チオコナゾール、チロフィバン、チザニジンH C 1、トラザミド、トルブタミド、トルカボン、トビラマート、トボテカン、トレミフェン、トシツモマブ、トラマドール、トラスツズマブ、トラゾドンH C 1、トレチノイン、トリアムシノロン、トリアムテレン、トリアゾラム、トリアゾール、トリフルプロマジン、トリメトプリム、マレイン酸トリミブラミン、トリフェニレン、トログリタゾン、トロメタミン、トロピカミド、トロバフロキサシン、チバメート、ユビデカレノン (コエンザイム Q 1 0)、ウンデセン酸、ウラシル、ウラシルマスタード、バルプロ酸、バルルピシン、バルサルタン、バンコマイシン、ベンラファキシンH C 1、ビガバトリン、ビンバルビタール、ビンブラスチン、ピンクリスチン、ピノレルピン、ポリコナ

ゾール、キサンチン、ザフィルルカスト、ジドブジン、ジレウトン、ゾレドロネート、ゾレドロロン酸、ゾルミトリプタン、ゾルピデムおよびゾピクロンからなる群から選択される、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 7】

前記親油性医薬用薬剤がブスルファン（1, 4 - ブタンジオールジメタンスルホネート）である、請求項 6 に記載の溶液。

【請求項 8】

前記親油性医薬用薬剤がイトラコナゾール（I t r a）またはボサコナゾール（P o s a）である、請求項 6 に記載の溶液。

【請求項 9】

界面活性剤を含まない、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 10】

前記両親媒性液体ポリマー溶媒が単一のポリマー型で構成される、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 11】

前記両親媒性液体ポリマー溶媒がポリエチレングリコール（P E G）である、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 12】

前記 P E G が P E G - 100、P E G - 200、P E G - 300、P E G - 400、P E G - 600 および P E G - 800 からなる群から選択される、請求項 11 に記載の溶液。

【請求項 13】

プロトン化剤をさらに含む、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 14】

前記プロトン化剤が酸、アルコールまたは酸性化アルコールである、請求項 13 に記載の溶液。

【請求項 15】

前記酸が H C l、クエン酸、酢酸またはグルタミン酸である、請求項 14 に記載の溶液。

【請求項 16】

約 1 ~ 約 6 の p H を有する、請求項 1 に記載の溶液。

【請求項 17】

請求項 1 に記載の非水性の均一な溶液を調製するための方法であって、
親油性医薬用薬剤、両親媒性液体ポリマー溶媒および揮発性有機溶媒を含む第 1 の非水性の均一な溶液を得るステップと、
前記第 1 の溶液から前記揮発性有機溶媒を除去して請求項 1 に記載の第 2 の非水性の均一な溶液を形成するステップと
を含む、方法。

【請求項 18】

前記揮発性有機溶媒が、アセトン、クロロホルム、脂肪族炭化水素、酢酸エチル、グリコールエーテル、ジエチルエーテルまたはエタノールである、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 19】

前記揮発性有機溶媒がアセトンである、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 20】

前記揮発性有機溶媒と前記両親媒性液体ポリマー溶媒の容積比が約 100 : 1 から 1 : 100 である、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 21】

前記揮発性有機溶媒と前記両親媒性液体ポリマー溶媒の容積比が約 1 : 2 または 1 : 3 である、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 22】

前記揮発性有機溶媒が酸性化されている、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 23】

前記除去するステップが約 10 ~ 80 の温度での除去である、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 24】

前記除去するステップが前記揮発性有機溶媒の蒸発を含む、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 25】

前記蒸発が真空を適用することによって促進される、請求項 24 に記載の方法。

【請求項 26】

前記第 2 の溶液を所望の水性希釈剤で希釈するステップをさらに含む、水性の均一な薬学的に許容される非経口製剤を調製するための方法とさらに規定される、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 27】

前記水性希釈剤が、ノーマルセーライン、ブドウ糖水および脂質ベースの注入乳濁液からなる群から選択される注入液である、請求項 26 に記載の方法。

【請求項 28】

前記水性希釈剤がプロトン化剤の添加によって改変される、請求項 26 に記載の方法。

【請求項 29】

前記水性希釈剤が、約 25% (vol / vol) までの少量の両親媒性ポリマーの添加によって改変される、請求項 26 に記載の方法。

【請求項 30】

前記両親媒性ポリマーが PEG である、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 31】

前記 PEG が PEG - 100、PEG - 200、PEG - 300、PEG - 400、PEG - 600 および PEG - 800 からなる群から選択される、請求項 26 に記載の方法。

【請求項 32】

請求項 17 ~ 31 のいずれか一項に記載の方法によって作製される、非水性の均一な溶液。

【請求項 33】

選択される親油性医薬用薬剤に感受性である疾患または状態を有する被験体を処置するための組成物であって、請求項 1 に記載の溶液を含み、前記親油性医薬用薬剤が前記選択される親油性医薬用薬剤であり、治療的有効量の前記組成物が非経口的に前記被験体に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 34】

前記被験体のがんを有するか、または骨髄移植もしくは造血始原細胞移植を実施するために前記被験体を前処置する必要性を有し、前記親油性医薬用薬剤がブスルファンである、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 35】

前記被験体が感染性疾患を有し、前記親油性医薬用薬剤が抗感染剤である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 36】

前記被験体が真菌、酵母またはかびの疾患を有し、前記親油性医薬用薬剤がアゾール剤である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 37】

前記被験体が細菌感染を有し、前記親油性医薬用薬剤が抗菌剤である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 38】

前記被験体がウイルス感染を有し、前記親油性医薬用薬剤が抗ウイルス剤である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 39】

前記被験体が精神学的な病気を有するか、または症状制御の必要性を有し、前記親油性医薬用薬剤が精神医学用薬剤である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 40】

前記精神医学用薬剤が抗精神病薬、抗うつ薬または鎮痛剤を含む、請求項 39 に記載の組成物。

【請求項 41】

前記被験体が意識レベルを変更するか、または全身麻酔を誘導する必要性を有し、前記親油性医薬用薬剤が意識レベル変更剤または麻酔剤である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 42】

前記組成物が血管内、腔内、髄腔内、皮下、筋肉内または局所的に投与される、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 43】

前記被験体が哺乳動物である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 44】

前記被験体がヒトである、請求項 33 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0045

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0045】

本発明の他の目的および利点は、以下の記載に一部示され、一部はこの記載から明らかとなるか、または本発明の実施から学ぶことができる。

一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目 1)

可溶化親油性医薬用薬剤および両親媒性液体ポリマー溶媒を含む非水性の均一な溶液であって、製剤が非ポリマー有機溶媒、水および非可溶化粒子を本質的に含有せず、前記可溶化親油性医薬用薬剤が少なくとも約 0.5 mg/mL の濃度を有し、さらに前記溶液が室温保存したときに少なくとも 40 日の間は安定で、非可溶化粒子を本質的に含有しない溶液。

(項目 2)

室温保存したときに少なくとも 60 日の間は安定で、非可溶化粒子を本質的に含有しない、項目 1 に記載の非水性の均一な溶液。

(項目 3)

項目 1 に記載の溶液を得るステップ、および前記溶液を所望の水性希釈剤で希釈するステップを含む方法によって調製される、水性の均一な薬学的に許容される非経口製剤。

(項目 4)

前記可溶化親油性医薬用薬剤が、約 1 ~ 10 mg/mL の濃度を有する、項目 1 に記載の溶液。

(項目 5)

前記可溶化親油性医薬用薬剤が、約 3 ~ 9 mg/mL の濃度を有する、項目 4 に記載の溶液。

(項目 6)

前記親油性医薬用薬剤が、7-メトキシブテリジン、7-メチルブテリジン、アバカビル、アバフンジン、アバレリックス、アセプトロール、アセナフテン、アセトアミノフェン、アセトアニリド、アセタゾラミド、アセトヘキサミド、アセトレチン、アクリバスチン、アデニン、アデノシン、アラトロフロキサシン、アルベンダゾール、アルブテロール、アルクロフェナック、アルデスロイキン、アレムツズマブ、アルフゾシン、アリトレチノイン、アロバルピタール、アロピュリノール、オールトランスレチノイン酸 (ATRA

)、アロキシブリン、アルブラゾラム、アルブレノロール、アルトレタミン、アミホスチン、アミロライド、アミノグルテチミド、アミノピリン、アミオダロンH C 1、アミトリプチリン、アムロジピン、アモバルピタール、アモジアキン、アモキサピン、アンフェタミン、アンホテリシン、アンホテリシンB、アンピシリン、アンブレナビル、アムサクリン、アミルニトレート、アミロバルピトン、アナストロゾール、アンリノン、アントラセン、アントラサイクリン、アプロバルピタール、三酸化ヒ素、アスパラギナーゼ、アスピリン、アステミゾール、アテノロール、アトルバスタチン、アトバクオン、アトラジン、アトロピン、アザチオプリン、オーラノフィン、アザシチジン、アザプロバゾン、アザチオプリン、アジンタミド、アジスロマイシン、アズトレオヌム、バクロフェン、バルピトン、B C G 生、ベクラミド、ベクロメタゾン、ベンドロフルメチアジド、ベネゼプリル、ベニジピン、ベノリレート、ベンペリドール、ベントゼパム、ベンズアミド、ベンズアントラセン、ベンザチンベニシリン、ベンズヘキサールH C 1、ベンズニダゾール、ベンゾジアゼピン、安息香酸、ベフェニウムヒドロキシナフトエート、ベタメタゾン、ベバシズマブ(アバスタチン)、ベキサロテン、ベザフィブラート、ビカルタミド、ビフォナゾール、ビペリデン、ビスコジル、ビスアントレン、プレオマイシン、プレオマイシン、ボルテゾミブ、プリンゾールアミド、プロマゼパム、メシル酸プロモクリブチン、プロムペリドール、プロチゾラム、プデソニド、プメタニド、ププロピオン、プスルファン、ブタルピタール、ブタンベン、ブテナフィンH C 1、ブトバルピトン(ブテタール)、ブトコナゾール、硝酸ブトコナゾール、ブチルパラベン、カフェイン、カルシフェジオール、カルシプロトリエン、カルシトリオール、カルステロン、カンベンダゾール、樟脳、カンプトセシン、カンプトセシン類似体、カンデサルタン、カベシタピン、カブサイシン、カプトプリル、カルバマゼピン、カルビマゾール、カルボフラン、カルボプラチン、カルプロマール、カリマゾール、カルムスチン、セファマンドール、セファゾリン、セフィキシム、セフトジジム、セフロキシムアキセチル、セレコキシブ、セフラジン、セリバスタチン、セトリジン、セツキシマブ、クロラムブシル、クロラムフェニコール、クロルジアゼボキシド、クロルメチアゾール、クロロキン、クロロチアジド、クロルフェニラミン、クロルプログアナールH C 1、クロルプロマジン、クロルプロバミド、クロルプロチキセン、クロルビリホス、クロルテトラサイクリン、クロロサリドン、クロルゾキサゾン、コレカルシフェロール、クリセン、シロスタゾール、シメチジン、シンナリジン、シノキサシン、シプロフィブラート、シプロフロキサシンH C 1、シサブリド、シスプラチン、シタロプラム、クラドリピン、クラリスロマイシン、フマル酸クレマスチン、クリオキノール、クロバザム、クロファラビン、クロファジミン、クロフィブラート、クエン酸クロミフェン、クロミブラミン、クロナゼパム、クロピドグレル、クロチアゼパム、クロトリマゾール、クロキサシリン、クロザピン、コカイン、コデイン、コルヒチン、コリスチン、抱合エストロゲン(c o n j u g a t e d e s t r o g e n)、コルチコステロン、コルチゾン、酢酸コルチゾン、シクリジン、シクロバルピタール、シクロベンザプリン、シクロブタン-スピロバルピツレート、シクロエタン-スピロバルピツレート、シクロヘブタン-スピロバルピツレート、シクロヘキサ-スピロバルピツレート、シクロペンタン-スピロバルピツレート、シクロホスファミド、シクロプロパン-スピロバルピツレート、シクロセリン、シクロスポリン、シプロヘブタジン、シプロヘブタジンH C 1、シタラビン、シトシン、ダカルバジン、ダクチノマイシン、ダナゾール、ダントロン、ダントロレンナトリウム、ダブソン、ダーベポエチン、ダロジピン、ダウノルビシン、デコキナート、デヒドロエピアンドロステロン、デラビルジン、デメクロサイクリン、デニロイキン、デオキシコルチコステロン、デソキシメタゾン、デキサメタゾン、デクスアンフェタミン、デクスクロルフェニラミン、デクスフェンフルアミン、デクスラゾキサシン、デキストロプロボキシフェン、ジアモルフィン、ジアトリゾ酸、ジアゼパム、ジアゾキシド、ジクロロフェン、ジクロルプロップ、ジクロフェナク、ジクマロール、ジダノシン、ジフルニサル、ジギトキシン、ジゴキシン、ジヒドロコデイン、ジヒドロエキリン、メシル酸ジヒドロエルゴタミン、ジヨードヒドロキシキノリン、ジルチアゼムH C 1、ジロキサニドフロエート、ジメンヒ

ドリナート、ジモルホラミン、ジニトルミド、ジオスゲニン、ジフェノキシレート H C 1
 、ジフェニル、ジピリダモール、ジリスロマイシン、ジソピラミド、ジスルフィラム、ジ
 ウロン、ドセタキセル、ドンペリドン、ドネベジル、ドキサゾシン、ドキサゾシン H C 1
 、ドキシソルピシン（中性）、ドキシソルピシン H C 1、ドキシサイクリン、プロピオン酸ド
 ロモスタノロン、ドロペリドール、ダイフィリン、エキノカンジン、エコナゾール、硝酸
 エコナゾール、エファビレンツ、エリブチシン、エナラプリル、エンリモマブ、エノキシ
 モン、エピネフリン、エピボドフィロトキシシン誘導体、エビルピシン、エボエチンアルフ
 ァ、エボサルタン、エキレニン、エキリン、エルゴカルシフェロール、酒石酸エルゴタミ
 ン、エルロチニブ、エリスロマイシン、エストラジオール、エストラムスチン、エストリ
 オール、エストロン、エタクリン酸、エタンブトール、エチナメート、エチオナミド、エ
 トプロパジン H C 1、エチル - 4 - アミノベンゾエート（ベンゾカイン）、エチルパラベ
 ン、エチニルエストラジオール、エトドラク、エトミデート、エトボシド、エトレチナ
 ート、エクセメスタン、フェルバマート、フェロジピン、フェンペンダゾール、フェンブコ
 ナゾール、フェンブフェン、フェンクロルホス、フェンクロフェナック、フェンフルラミ
 ン、フェノフィブレート、フェノルデパム、フェノプロフェンカルシウム、フェノキシカ
 ルブ、フェンピクロニル、フェンタニル、フェンチコナゾール、フェキソフェナジン、フ
 ィルグラスチム、フィナステリド、酢酸フレカミド、フロクシウリジン、フルダラビン、
 フルコナゾール、フルシトシン、フルジオキソニル、フルドロコルチゾン、酢酸フルドロ
 コルチゾン、フルフェナム酸、フルナニゾン、フルナリジン H C 1、フルニソリド、フル
 ニトラゼパム、フルオコルトロン、フルオメツロン、フルオレン、フルオロウラシル、フ
 ルオキセチン H C 1、フルオキシメステロン、デカン酸フルベンチキソール、フルラゼパ
 ム、フルルビプロフェン、プロピオン酸フルチカゾン、フルバスタチン、葉酸、ホセノブ
 リル、ホスフェニトインナトリウム、フロバトリブタン、フルセミド、フルベストラント
 、フラゾリドン、ガバベンチン、G - B H C（リンダン）、ゲフィチニブ、ゲムシタピン
 、ゲムフィブロジル、ゲムツズマブ、グラフェニン、グリベンクラミド、グリクラジド、
 グリメピリド、グリビジド、グルテチミド、グリブリド、グリセリルトリニトレート（ニ
 トログリセリン）、酢酸ゴセレリン、グレパフロキサシン、グリセオフルビン、グアイフ
 エネシン、酢酸グアナベンズ、グアニン、ハロファントリン H C 1、ハロペリドール、ヒ
 ドロクロロチアジド、ヘプタバルピタール、ヘロイン、ヘスペレチン、ヘキサクロロベン
 ゼン、ヘキセタール、酢酸ヒストレリン、ヒドロコルチゾン、ヒドロフルメサイアザイド
 、ヒドロキシ尿素、ヒヨスチアミン、ヒボキサンチン、イブリツモマブ、イブプロフェン
 、イダルピシン、イドブタール、イホスファミド、イヒドロエキレニン、メシル酸イマチ
 ニブ、イミベネム、インダパミド、インジナビル、インドメタシン、インドプロフェン、
 インターフェロン - 2 a、インターフェロン - 2 b、ヨーダミド、ヨーバン酸、イブ
 ロジオン、イルベサルタン、イリノテカン、イサブコナゾール、イソカルボキサジド、イ
 ソコナゾール、イソグアニン、イソニアジド、イソプロビルバルビツレート、イソプロチ
 ユロン、二硝酸イソソルビド、一硝酸イソソルビド、イスラジピン、イトラコナゾール、
 イトラコナゾール、イトラコナゾール（I t r a）、イベルメクチン、ケトコナゾール、
 ケトコナゾール、ケトプロフェン、ケトロラク、ケーリン、ラベタロール、ラミブジン、
 ラモトリジン、ラナトシド C、ラノスプラゾール、L - D O P A、レフルノミド、レナリ
 ドマイド、
 レトロゾール、ロイコボリン、酢酸ロイプロリド、レバミゾール、レボフロキサシン、リ
 ドカイン、リニユロン、リシノプリル、ロメフロキサシン、ロムスチン、ロペラミド、ロ
 ラタジン、ロラゼパム、ロレフロキサシン、ロルメタゼパム、メシル酸ロサルタン、ロバ
 スタチン、マレイン酸リスリド、マプロチリン H C 1、マジンドール、メベンダゾール、
 メクリジン H C 1、メクロフェナム酸、メダゼパム、メジゴキシシン、酢酸メドロキシプロ
 ゲステロン、メフェナム酸、メフロキン H C 1、酢酸メゲストロール、メルファラン、臭
 化メペンゾラート、メプロバメート、メブタジノール、メルカプトプリン、メサラジン、
 メスナ、メソリダジン、メストラノール、メサドン、メタカロニ、メトカルバモール、メ
 トイン、メトトレキセート、メトキサレン、メトスクシミド、メチクロロチアジド、メチル

フェニデート、メチルフェノバルビトン、メチル - p - ヒドロキシベンゾエート、メチル
 プレドニゾロン、メチルテストステロン、メチプリロン、マレイン酸メチセルジド、メト
 クロブラミド、メトラゾン、メトプロロール、メトロニダゾール、ミアンセリン H C 1、
 ミコナゾール、ミダゾラム、ミフェプリストーン、ミグリトール、ミノサイクリン、ミノ
 キシジル、マイトマイシン C、ミトタン、ミトキサントロン、モフェチルマイコフェノレ
 ート、モリンドン、モンテルカスト、モルヒネ、モキシフロキサシン H C 1、ナブメトン
 、ナドロール、ナルブフィン、ナリジクス酸、ナンドロロン、ナфтаセン、ナфтаレン、
 ナプロキセン、ナラトリブタン H C 1、ナタマイシン、ナタマイシン、ネララビン、ネル
 フィナビル、ネビラビン、ニカルジピン H C 1、ニコチンアミド、ニコチン酸、ニクマロ
 ン、ニフェジピン、ニルタミド、ニモジピン、ニモラゾール、ニソルジピン、ニトラゼバ
 ム、ニトロフラントイン、ニトロフラゾン、ニザチジン、ノフェツモマブ、ノルエチステ
 ロン、ノルフロキサシン、ノルゲストレル、ノルトリブチリン H C 1、ナイスタチン、エ
 ストラジオール、オフロキサシン、オランザピン、オメブラゾール、オモコナゾール、オ
 ンダンセトロン H C 1、オブレルベキン、オルニダゾール、オキサリプラチン、オキサム
 ニキン、オキサントレムボネート、オキサプロジン、オキサトミド、オキサゼバム、オク
 スカルバゼピン、オクスフェンダゾール、オキシコナゾール、オクスブレノロール、オキ
 シフェンブタゾン、オキシフェンサイクリミン H C 1、バクリタキセル、バリフェルミン
 、パミドロン酸、p - アミノサリチル酸、パントブラゾール、パラメタジオン、パロксе
 チン H C 1、ペガデマーズ、ペガスバルガーゼ、ペグフィルグラスチム、ペメトレキセド
 ニナトリウム、ペニシラミン、四硝酸ペンタエリスリトール、ペンタゾシン、ペントバル
 ビタール、ペントバルビトン、ペントスタチン、ペントキシフィリン、ペルフェナジン、
 ペルフェナジンピモジド、ペリレン、フェナセミド、フェナセチン、フェナントレン、フ
 ェニンジオン、フェノバルビタール、フェノールバルビトン、フェノールフタレイン、フ
 ェノキシベンザミン、フェノキシベンザミン H C 1、フェノキシメチルペニシリン、フェ
 ンスクシミド、フェニルブタゾン、フェニトイン、ピンドロール、ピオグリタゾン、ピボ
 プロマン、ピロキシカム、マレイン酸ピゾチフェン、白金化合物、プリカマイシン、ポリ
 エン、ポリミキシシン B、ポルフィマーナトリウム、ボサコナゾール (P o s a)、プラミ
 ベキソール、プラステロン、プラバスタチン、ブラジカンテル、ブラゾシン、ブラゾシン
 H C 1、プレドニソロン、プレドニゾン、プリミドン、プロバルビタール、プロベネシド
 、プロブコール、プロカルバジン、プロクロルペラジン、プロゲステロン、プロゲアニル
 H C 1、プロメタジン、プロボフォール、プロボクスル、プロブラノロール、プロビルバ
 ラベン、プロビルチオウラシル、プロスタグランジン、プソイドエフェドリン、プテリジ
 ン - 2 - メチル - チオール、プテリジン - 2 - チオール、プテリジン - 4 - メチル - チオ
 ール、プテリジン - 4 - チオール、プテリジン - 7 - メチル - チオール、プテリジン - 7
 - チオール、ピランテルエンボネート、ピラジナミド、ピレン、ピリドスチグミン、ピリ
 メタミン、クエチアピン、キナクリン、キナプリル、キニジン、硫酸キニジン、キニーネ
 、硫酸キニン、ラベプラゾールナトリウム、ラニチジン H C 1、ラスブリケース、ラブコ
 ナゾール、レバグリニド、レボサル、レセルピン、レチノイド、リファブチン、リファ
 ンピシン、リファペンチン、リメキシロン、リスペリドン、リトナビル、リツキシマブ、
 安息香酸リザトリブタン、ロフェコキシブ、ロビニロール H C 1、ロシグリタゾン、サッ
 カリン、サルブタモール、サリチルアミド、サリチル酸、サキナビル、サルグラモスチム
 、セクブタバルビタール、セコバルビタール、セルタコナゾール、セルチンドール、セル
 トラリン H C 1、シンバスタチン、シロリムス、ソラフェニブ、スバルフロキサシン、ス
 ピラマイシン、スピロノラクトン、スタノローン、スタノゾロール、スタブジン、スチル
 ベストロール、ストレプトゾシン、ストリキニーネ、スルコナゾール、硝酸スルコナゾ
 ル、スルファセタミド、スルファジアジン、スルファメラジン、スルファメタジン、スル
 ファメトキサゾール、スルファニルアミド、スルファチアゾール、スリンダク、スルファ
 ベンズアミド、スルファセタミド、スルファジアジン、スルファドキシシン、スルファフラ
 ザール、スルファメラジン、スルファメトキサゾール、スルファピリジン、スルファサラ
 ジン、スルフィンピラゾン、スルピリド、スルチアム、コハク酸スマトリブタン、マレイ

ン酸スニチニブ、タクリン、タクロリムス、タルブタール、クエン酸タモキシフェン、タムロシン、タルグレチン、タキサン、タザロテン、テルミサルタン、テマゼバム、テモゾロマイド、テニボシド、テノキシカム、テラゾシン、テラゾシンHCl、テルビナフィンHCl、硫酸テルブタリン、テルコナゾール、テルフェナジン、テストラクトン、テストステロン、テトラサイクリン、テトラヒドロカンナビノール、テトロキソプリム、サリドマイド、テバイン、

テオブロミン、テオフィリン、チアベンダゾール、チアンフェニコール、チオグアニン、チオリダジン、チオテパ、トトイン、チミン、チアガビンHCl、チボロン、チクロピジン、チニダゾール、チオコナゾール、チロフィパン、チザニジンHCl、トラザミド、トルブタミド、トルカボン、トピラマート、トボテカン、トレミフェン、トシツモマブ、トラマドール、トラスツズマブ、トラゾドンHCl、トレチノイン、トリアムシノロン、トリアムテレン、トリアゾラム、トリアゾール、トリフルプロマジン、トリメトプリム、マレイン酸トリミプラミン、トリフェニレン、トログリタゾン、トロメタミン、トロピカミド、トロパフロキサシン、チバメート、ユビデカレノン(コエンザイムQ10)、ウンデセン酸、ウラシル、ウラシルマスタード、バルプロ酸、バルルピシン、バルサルタン、バンコマイシン、ベンラファキシンHCl、ビガパトリン、ピンバルピタール、ピンブラスチン、ピンクリスチン、ピノレルビン、ポリコナゾール、キサンチン、ザフィルルカスト、ジドブジン、ジレウトン、ゾレドロネート、ゾレドロロン酸、ゾルミトリブタン、ゾルピデムおよびゾピクロンからなる群から選択される、項目1に記載の溶液。

(項目7)

抗がん剤がブスルファン(1,4-ブタンジオールジメタンスルホネート)である、項目6に記載の溶液。

(項目8)

アゾール剤がイトラコナゾール(Itra)またはボサコナゾール(Posa)である、項目6に記載の溶液。

(項目9)

界面活性剤を含まない、項目1に記載の溶液。

(項目10)

前記両親媒性液体ポリマー溶媒が単一のポリマー型で構成される、項目1に記載の溶液。

(項目11)

前記両親媒性液体ポリマー溶媒がポリエチレングリコール(PEG)である、項目1に記載の溶液。

(項目12)

前記PEGがPEG-100、PEG-200、PEG-300、PEG-400、PEG-600およびPEG-800からなる群から選択される、項目11に記載の溶液。

(項目13)

プロトン化剤をさらに含む、項目1に記載の溶液。

(項目14)

前記プロトン化剤が酸、アルコールまたは酸性化アルコールである、項目13に記載の溶液。

(項目15)

前記酸がHCl、クエン酸、酢酸またはグルタミン酸である、項目14に記載の溶液。

(項目16)

約1~約6のpHを有する、項目1に記載の溶液。

(項目17)

項目1に記載の非水性の均一な溶液を調製するための方法であって、

親油性医薬用薬剤、両親媒性液体ポリマー溶媒および揮発性有機溶媒を含む第1の非水性の均一な溶液を得るステップと、

前記第1の溶液から前記揮発性有機溶媒を除去して項目1に記載の第2の非水性の均一

な溶液を形成するステップと
を含む、方法。

(項目 1 8)

前記揮発性有機溶媒が、アセトン、クロロホルム、脂肪族炭化水素、酢酸エチル、グリ
コールエーテル、ジエチルエーテルまたはエタノールである、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 1 9)

前記揮発性有機溶媒がアセトンである、項目 1 8 に記載の方法。

(項目 2 0)

前記揮発性有機溶媒と前記両親媒性液体ポリマー溶媒の容積比が約 1 0 0 : 1 から 1 :
1 0 0 である、項目 1 8 に記載の方法。

(項目 2 1)

前記揮発性有機溶媒と前記両親媒性液体ポリマー溶媒の容積比が約 1 : 2 または 1 : 3
である、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 2 2)

前記揮発性有機溶媒が酸性化されている、項目 1 7 に記載の溶液。

(項目 2 3)

前記除去するステップが約 1 0 ~ 8 0 の温度での除去である、項目 1 7 に記載の方法
。

(項目 2 4)

前記除去するステップが前記揮発性有機溶媒の蒸発を含む、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 5)

前記蒸発が真空を適用することによって促進される、項目 2 4 に記載の方法。

(項目 2 6)

前記第 2 の溶液を所望の水性希釈剤で希釈するステップをさらに含む、水性の均一な薬
学的に許容される非経口製剤を調製するための方法とさらに規定される、項目 1 7 に記載
の方法。

(項目 2 7)

前記水性希釈剤が、ノーマルセーライン、ブドウ糖水および脂質ベースの注入乳濁液か
らなる群から選択される注入液である、項目 2 6 に記載の方法。

(項目 2 8)

前記水性希釈剤がプロトン化剤の添加によって改変される、項目 2 6 に記載の方法。

(項目 2 9)

前記水性希釈剤が、約 2 5 % (v o l / v o l) までの少量の両親媒性ポリマーの添加
によって改変される、項目 2 6 に記載の方法。

(項目 3 0)

前記両親媒性ポリマーが P E G である、項目 2 6 に記載の方法。

(項目 3 1)

前記 P E G が P E G - 1 0 0、P E G - 2 0 0、P E G - 3 0 0、P E G - 4 0 0、P
E G - 6 0 0 および P E G - 8 0 0 からなる群から選択される、項目 2 6 に記載の方法。

(項目 3 2)

項目 1 7 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の方法によって作製される、非水性の均一な溶液
。

(項目 3 3)

選択される親油性医薬用薬剤に感受性である疾患または状態を有する被験体を処置する
ための方法であって、治療的有効量の、項目 1 に記載の溶液を含む組成物を非経口的に前
記被験体に投与するステップを含み、前記親油性医薬用薬剤が前記選択される親油性医薬
用薬剤である、方法。

(項目 3 4)

前記被験体のがんを有するか、または骨髓移植もしくは造血始原細胞移植を実施するた
めに前記被験体を前処置する必要性を有し、前記親油性医薬用薬剤がブスルファンである

、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 3 5)

前記被験体が感染性疾患を有し、前記親油性医薬用薬剤が抗感染剤である、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 3 6)

前記被験体が真菌、酵母またはかびの疾患を有し、前記親油性医薬用薬剤がアゾール剤である、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 3 7)

前記被験体が細菌感染を有し、前記親油性医薬用薬剤が抗菌剤である、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 3 8)

前記被験体がウイルス感染を有し、前記親油性医薬用薬剤が抗ウイルス剤である、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 3 9)

前記被験体が精神学的な病気を有するか、または症状制御の必要性を有し、前記親油性医薬用薬剤が精神医学用薬剤である、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 4 0)

前記精神医学用薬剤が抗精神病薬、抗うつ薬または鎮痛剤を含む、項目 3 9 に記載の方法。

(項目 4 1)

前記被験体が意識レベルを変更するか、または全身麻酔を誘導する必要性を有し、前記親油性医薬用薬剤が意識レベル変更剤または麻酔剤である、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 4 2)

前記組成物が血管内、腔内、髄腔内、皮下、筋肉内または局所的に投与される、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 4 3)

前記被験体が哺乳動物である、項目 3 3 に記載の方法。

(項目 4 4)

前記被験体がヒトである、項目 3 3 に記載の方法。