

【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26年12月4日 (2014.12.4)

【公表番号】特表2014-512396(P2014-512396A)

【公表日】平成26年5月22日 (2014.5.22)

【年通号数】公開・登録公報2014-027

【出願番号】特願2014-506723(P2014-506723)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 25/18

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/02

【手続補正書】

【提出日】平成26年10月20日 (2014.10.20)

【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】

リスペリドン、その塩、9 - ヒドロキシリスペリドン、及びその塩から選択される活性成分と；

第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）及び第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）を含むポリマーブレンドと、
を含む医薬組成物であって、前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）と前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）との重量比が、（ 5 0 ～ 9 5 ）：（ 5 ～ 5 0 ）であり、前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、 $0.4 \text{ d l } / \text{ g } \sim 0.9 \text{ d l } / \text{ g }$ の固有粘度を有し、重量平均分子量が $50,000 \sim 145,000$ であり、ラクチドとグリコリドとのモル比が $65 : 35 \sim 90 : 10$ の範囲内であり；前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、 $0.1 \text{ d l } / \text{ g } \sim$

0.35 d1 / g の固有粘度を有し、重量平均分子量が 4,000 ~ 45,000 であり、ラクチドとグリコリドとのモル比が、50 : 50 ~ 75 : 25 の範囲内であり；該医薬組成物中の前記活性成分の重量含有率が、10 % ~ 60 % の範囲内であり；該医薬組成物中の前記ポリマーブレンドの重量含有率が、40 % ~ 90 % の範囲内であり；該医薬組成物がミクロスフェアの形態で存在する、医薬組成物。

【請求項 2】

前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、0.45 d1 / g ~ 0.8 d1 / g の固有粘度を有し；前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、0.1 d1 / g ~ 0.3 d1 / g の固有粘度を有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、0.45 d1 / g ~ 0.55 d1 / g の固有粘度を有し；前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、0.2 d1 / g ~ 0.3 d1 / g の固有粘度を有する、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、55,000 ~ 110,000 の重量平均分子量であり；前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、4,000 ~ 35,000 の重量平均分子量である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、55,000 ~ 85,000 の重量平均分子量であり；前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）が、15,000 ~ 35,000 の重量平均分子量である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

該医薬組成物中の前記活性成分の重量含有率が、35 % ~ 55 % の範囲内であり；該医薬組成物中の前記ポリマーブレンドの重量含有率が、45 % ~ 65 % の範囲内である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

該医薬組成物中の前記活性成分の重量含有率が、40 % ~ 50 % の範囲内であり；該医薬組成物中の前記ポリマーブレンドの重量含有率が、50 % ~ 60 % の範囲内である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記ポリマーブレンドが、前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）と前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）とからなる、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）と前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）との重量比が、(70 ~ 90) : (10 ~ 30) ある、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）と第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）の重量比が、80 : 20 である、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記第 1 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）中のラクチドとグリコリドとのモル比が、75 : 25 でありの範囲内であり；前記第 2 の非キャップポリ（ラクチド - コ - グリコリド）中のラクチドとグリコリドとのモル比が、50 : 50 の範囲内である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

リスペリドンの重量含有率が45%であり、前記ポリマーブレンドの重量含有率が55%であり、前記第1の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)と前記第2の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)との重量比が80:20であり、前記第1の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)の固有粘度が0.45 dL/g ~ 0.55 dL/gであり、前記第2の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)の固有粘度が0.2 dL/g ~ 0.3 dL/gであり、前記第1の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)中のラクチドとグリコリドとのモル比が75:25であり、前記第2の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)中のラクチドとグリコリドとのモル比が50:50である、請求項1~5のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項13】

リスペリドンの重量含有率が45%であり、前記ポリマーブレンドの重量含有率が55%であり、前記第1の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)と前記第2の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)との重量比が80:20であり、前記第1の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)の分子量が55,000~85,000であり、前記第2の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)の分子量が15,000~35,000であり、前記第1の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)中のラクチドとグリコリドとのモル比が75:25であり、前記第2の非キャップポリ(ラクチド-コ-グリコリド)中のラクチドとグリコリドとのモル比が50:50である、請求項1~5のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項14】

リスペリドン又は9-ヒドロキシリスペリドンの塩が無機酸塩及び有機酸塩から選択され、該無機酸塩が、塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫酸塩及びリン酸塩から選択され、該有機酸塩が、酢酸塩、プロピオン酸塩、ヒドロキシ酢酸塩、2-ヒドロキシプロピオン酸塩、パモ酸塩、2-オキシプロピオン塩酸、シュウ酸塩、マロン酸塩、コハク酸塩、2-ブテン二酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩及びトルエンスルホン酸塩から選択される、請求項1~5のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項15】

抗精神病薬の調製における請求項1~5のいずれか一項に記載の医薬組成物の使用であって、精神病は、急性統合失調症及び慢性統合失調症と、他の精神病的状態の重篤な陽性症状及び重篤な陰性症状と、統合失調症に関連する感情症状とを含む、医薬組成物の使用。

【請求項16】

請求項1~5のいずれか一項に記載の医薬組成物を含む、注射用徐放性ミクロスフェア。

【請求項17】

請求項1~5に記載の医薬組成物、及びマンニトールを含む、請求項16に記載の注射用徐放性ミクロスフェア。

【請求項18】

前記ミクロスフェアを薬学的に許容される分散溶媒中に懸濁させ、該分散溶媒が、懸濁化剤、pH調節剤、等張調整剤、界面活性剤、水及び生理食塩水から選択され、該懸濁化剤が、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、アルギン酸ナトリウム及びグリセロールから選択され、該等張調整剤が、塩化ナトリウム、グルコース、マンニトール及びグルシトールから選択され、該界面活性剤が非イオン界面活性剤であり、ポリソルベート系及びポロキサマー系から選択される、請求項16又は17に記載の注射用徐放性ミクロスフェア。