

【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6月9日 (2016.6.9)

【公表番号】特表2015-514751(P2015-514751A)

【公表日】平成27年5月21日 (2015.5.21)

【年通号数】公開・登録公報2015-034

【出願番号】特願2015-506529(P2015-506529)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 31/497

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

【手続補正書】

【提出日】平成28年4月15日 (2016.4.15)

【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】

難溶性薬物、分散媒、及び懸濁化剤を含み、  
 該懸濁化剤は、少なくともポリエチレングリコール及びカルボキシメチルセルロース又はその塩を含み、  
 粘度をレオメーターにより測定すると、  
 剪断速度  $0.01 \sim 0.02 \text{ s}^{-1}$  の範囲の少なくとも 1 点において  $40 \text{ Pa} \cdot \text{s}$  以上の値が測定され、  
 剪断速度  $900 \sim 1,000 \text{ s}^{-1}$  の範囲の少なくとも 1 点において  $0.2 \text{ Pa} \cdot \text{s}$  以下の値が測定される、  
 組成物  
 を含む、注射製剤。

【請求項 2】

難溶性薬物、分散媒、及び懸濁化剤を含み、  
 該懸濁化剤は、少なくともポリエチレングリコール及びカルボキシメチルセルロース又はその塩を含み、

25 において粘度をレオメーターにより測定すると、  
剪断速度  $0.01 \sim 0.02 \text{ s}^{-1}$  の範囲の少なくとも1点において  $40 \text{ Pa} \cdot \text{s}$  以上の  
値が測定され、  
剪断速度  $900 \sim 1,000 \text{ s}^{-1}$  の範囲の少なくとも1点において  $0.2 \text{ Pa} \cdot \text{s}$  以下  
の値が測定される、

組成物

を含む、注射製剤。

【請求項3】

分散媒として少なくとも水を含む組成物を含む、請求項1又は2に記載の注射製剤。

【請求項4】

懸濁化剤の濃度が  $0.05 \sim 150 \text{ mg/mL}$  である、

請求項1～3のいずれか一項に記載の注射製剤。

【請求項5】

難溶性薬物が、アリピプラゾール又はその塩、あるいは7-[4-(4-ベンゾ[b]  
チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)ブトキシ]-1H-キノリン-2-オン  
又はその塩である、請求項1～4のいずれか一項に記載の注射製剤。

【請求項6】

難溶性薬物として、アリピプラゾール又はその塩、あるいは7-[4-(4-ベンゾ[b]  
チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)ブトキシ]-1H-キノリン-2-  
オン又はその塩、

水、及び

少なくともポリエチレングリコール及びカルボキシメチルセルロース又はその塩を含む懸  
濁化剤

を含み、

前記難溶性薬物の平均一次粒子径が  $0.5 \sim 30 \mu\text{m}$  であり、

前記難溶性薬物の濃度が  $200 \sim 600 \text{ mg/mL}$  である、

ゲル状組成物。

【請求項7】

懸濁化剤の濃度が  $0.05 \sim 150 \text{ mg/mL}$  である、

請求項6に記載の組成物。

【請求項8】

ポリエチレングリコールの濃度が  $0.05 \sim 2 \text{ mg/mL}$  であり、

カルボキシメチルセルロース又はその塩の濃度が  $0.5 \sim 50 \text{ mg/mL}$  である、

請求項6又は7に記載の組成物。

【請求項9】

前記難溶性薬物の平均二次粒子径が、平均一次粒子径の3倍以下である、請求項6～8  
のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項10】

粘度をレオメーターにより測定すると、

剪断速度  $0.01 \sim 0.02 \text{ s}^{-1}$  の範囲の少なくとも1点において  $40 \text{ Pa} \cdot \text{s}$  以上の  
値が測定され、

剪断速度  $900 \sim 1,000 \text{ s}^{-1}$  の範囲の少なくとも1点において  $0.2 \text{ Pa} \cdot \text{s}$  以下  
の値が測定される

請求項6～9のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項11】

25 において粘度をレオメーターにより測定すると、

剪断速度  $0.01 \sim 0.02 \text{ s}^{-1}$  の範囲の少なくとも1点において  $40 \text{ Pa} \cdot \text{s}$  以上の  
値が測定され、

剪断速度  $900 \sim 1,000 \text{ s}^{-1}$  の範囲の少なくとも1点において  $0.2 \text{ Pa} \cdot \text{s}$  以下  
の値が測定される

請求項 6 ~ 9 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 2】

請求項 6 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の組成物を含む注射製剤。

【請求項 1 3】

請求項 6 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の組成物がプレフィルドされたプレフィルドシリンジ。

【請求項 1 4】

請求項 1 3 に記載のプレフィルドシリンジを備えたキット。

【請求項 1 5】

アリピプラゾール又はその塩、あるいは 7 - [ 4 - ( 4 - ベンゾ [ b ] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) ブトキシ ] - 1 H - キノリン - 2 - オン又はその塩を、  
2 0 0 ~ 6 0 0 m g / m L 、

水、及び

少なくとももポリエチレングリコール及びカルボキシメチルセルロース又はその塩を含む懸濁化剤

を含み、

前記アリピプラゾール又はその塩、あるいは 7 - [ 4 - ( 4 - ベンゾ [ b ] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) ブトキシ ] - 1 H - キノリン - 2 - オン又はその塩の平均一次粒子径が 0 . 5 ~ 3 0  $\mu$  m である

混合液を

5 ~ 7 0 で 5 分以上静置すること、

を含む、

アリピプラゾール又はその塩、あるいは 7 - [ 4 - ( 4 - ベンゾ [ b ] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) ブトキシ ] - 1 H - キノリン - 2 - オン又はその塩を含有するゲル状組成物の製造方法。

【請求項 1 6】

アリピプラゾール又はその塩、あるいは 7 - [ 4 - ( 4 - ベンゾ [ b ] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) ブトキシ ] - 1 H - キノリン - 2 - オン又はその塩を 2 0 0 ~ 6 0 0 m g / m L 、

水、及び

少なくとももポリエチレングリコール及びカルボキシメチルセルロース又はその塩を含む懸濁化剤

を含み、

前記アリピプラゾール又はその塩、あるいは 7 - [ 4 - ( 4 - ベンゾ [ b ] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) ブトキシ ] - 1 H - キノリン - 2 - オン又はその塩の平均一次粒子径が 0 . 5 ~ 3 0  $\mu$  m である

混合液を

シリンジ中に充填すること、並びに

上記混合液を 5 ~ 7 0 で 5 分以上静置すること、

を含む、

アリピプラゾール又はその塩、あるいは 7 - [ 4 - ( 4 - ベンゾ [ b ] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) ブトキシ ] - 1 H - キノリン - 2 - オン又はその塩を含有するゲル状組成物がプレフィルドされたプレフィルドシリンジの製造方法。

【請求項 1 7】

難溶性薬物として、アリピプラゾール又はその塩、あるいは 7 - [ 4 - ( 4 - ベンゾ [ b ] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル ) ブトキシ ] - 1 H - キノリン - 2 - オン又はその塩、

水、及び

少なくとももポリエチレングリコール及びカルボキシメチルセルロース又はその塩を含む懸濁化剤

前記難溶性薬物の平均一次粒子径が $1 \sim 10 \mu\text{m}$ であり、  
前記難溶性薬物の濃度が $200 \sim 400 \text{mg/mL}$ であり、  
静置時にはゲル状で衝撃によりゾル化する、  
組成物を含む、

1ヶ月当たり1回投与される持効性注射製剤。

【請求項18】

前記難溶性薬物の平均一次粒子径が $2 \sim 7 \mu\text{m}$ である、請求項17に記載の注射製剤。

【請求項19】

難溶性薬物として、アリピプラゾール又はその塩、あるいは7-[4-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)ブトキシ]-1H-キノリン-2-オン又はその塩、  
水、及び

少なくともポリエチレングリコール及びカルボキシメチルセルロース又はその塩を含む懸濁化剤

前記難溶性薬物の平均一次粒子径が $4 \sim 30 \mu\text{m}$ であり、  
前記難溶性薬物の濃度が $300 \sim 600 \text{mg/mL}$ である  
組成物を含み、

静置時にはゲル状で衝撃によりゾル化する、

2～3ヶ月当たり1回投与される持効性注射製剤。

【請求項20】

前記難溶性薬物の平均一次粒子径が $5 \sim 20 \mu\text{m}$ である、請求項19に記載の注射製剤。

【請求項21】

懸濁化剤の濃度が $0.05 \sim 150 \text{mg/mL}$ である、  
請求項17～20のいずれか一項に記載の注射製剤。

【請求項22】

ポリエチレングリコールの濃度が $0.05 \sim 2 \text{mg/mL}$ であり、  
カルボキシメチルセルロース又はその塩の濃度が $0.5 \sim 50 \text{mg/mL}$ である、  
請求項17～21のいずれか一項に記載の注射製剤。

【請求項23】

前記難溶性薬物の平均二次粒子径が、平均一次粒子径の3倍以下である、請求項17～22のいずれか一項に記載の注射製剤。

【請求項24】

統合失調症、双極性障害、若しくはうつの治療又は再発予防用である、請求項1～5、  
12、17～23のいずれかに記載の注射製剤。

【請求項25】

筋肉内又は皮下に投与される、請求項24に記載の注射製剤。