

【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21年2月5日 (2009.2.5)

【公表番号】特表2008-524136(P2008-524136A)

【公表日】平成20年7月10日 (2008.7.10)

【年通号数】公開・登録公報2008-027

【出願番号】特願2007-545905(P2007-545905)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/549 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 235/08 (2006.01)

C 0 7 D 285/24 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/549

A 6 1 P 9/12

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/18

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 D 235/08

C 0 7 D 285/24

【手続補正書】

【提出日】平成20年12月9日 (2008.12.9)

【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】**

活性成分として約80mgのアンギオテンシンII受容体アンタゴニストテルミサルタンと、約25mgの利尿薬ヒドロクロロチアジドとを含む、高血圧の治療用医薬組成物。

**【請求項 2】**

活性成分として約160mgのアンギオテンシンII受容体アンタゴニストテルミサルタンと、約50mgの利尿薬ヒドロクロロチアジドとを含む、高血圧の治療用医薬組成物であって、半分に分割できる前記組成物。

**【請求項 3】**

前記医薬組成物が錠剤又はカプセル剤である、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

**【請求項 4】**

前記医薬組成物が、即時放出特性を有する溶解性錠剤マトリックス中の前記成分テルミサルタンを含有する、請求項 3 に記載の組成物。

**【請求項 5】**

前記利尿薬ヒドロクロロチアジドが、崩壊性医薬マトリックス中の別個の層を形成している、請求項 3 に記載の組成物。

**【請求項 6】**

テルミサルタン又はその塩が実質的に非晶質形態である、請求項 3 に記載の組成物。

**【請求項 7】**

不活性成分として、水酸化ナトリウム、メグルミン、ポビドン、ソルビトール、ステアリン酸マグネシウム、ラクトース水和物、微結晶性セルロース、トウモロコシデンプン及びナトリウムデンプングリコレートを含む、請求項 3 に記載の組成物。

**【請求項 8】**

前記溶解性錠剤マトリックスが、塩基性薬剤、水溶性希釈剤を含み、かつ任意に他の賦形剤及びアジュバントを含んでよい、請求項 4 に記載の組成物。

**【請求項 9】**

前記塩基性薬剤が、アルカリ金属の水酸化物、塩基性アミノ酸及びメグルミンから選択される、請求項 8 に記載の組成物。

**【請求項 10】**

前記水溶性希釈剤が、グルコース等の単糖類；スクロース及びラクトース等のオリゴ糖類；及びソルビトール、マンニトール、エリスロール及びキシリトール等の糖アルコール類から選択される、請求項 8 に記載の組成物。

**【請求項 11】**

前記他の賦形剤及びアジュバントが、結合剤、担体、充填剤、潤沢剤、流れ調整剤、結晶化遅延剤、可溶化剤、着色剤、pH調整剤、界面活性剤及び乳化剤から選択される、請求項 8 に記載の組成物。

**【請求項 12】**

前記錠剤マトリックスが、テルミサルタンと塩基性薬剤を含む水溶液を噴霧-乾燥させて噴霧-乾燥顆粒を製造し、前記噴霧-乾燥顆粒を水溶性希釈剤と混合してプレミックスを製造し、前記プレミックスを潤沢剤と混合して最終ブレンドを製造し、かつ前記最終ブレンドを圧縮して第 1 錠剤層を形成することによって製造される、請求項 8 に記載の組成物。

**【請求項 13】**

前記崩壊性錠剤マトリックスが、充填剤、結合剤、崩壊剤を含み、かつ任意に他の賦形剤及びアジュバントを含んでよい、請求項 5 に記載の組成物。

**【請求項 14】**

前記他の賦形剤及びアジュバントが、担体、希釈剤、潤沢剤、流れ調整剤、可溶化剤、抗酸化剤、着色剤、pH調整剤、界面活性剤及び乳化剤から選択される、請求項 13 に記載の組成物。

**【請求項 15】**

前記医薬組成物が、アルミニウムホイルブリストパック又はポリプロピレンチューブ及びHDPEボトル等の防湿包装材料で包装されている、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 16】

血圧が、アンギオテンシンII受容体アンタゴニストによる治療又は前記アンギオテンシンII受容体アンタゴニストと低用量のHCTZの併用では十分に制御されない患者用である、請求項 1 ～ 15 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 17】

前記患者が、低い血漿レニン活性又は血漿レニン濃度を有する、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

さらに、脳卒中、心筋梗塞、一過性脳虚血発作、うっ血性心不全、心臓血管疾患、インスリン抵抗性、耐糖能障害、プレ糖尿病、2型糖尿病、代謝症候群(症候群X)、肥満症、高トリグリセリド血症、C-反応性タンパク質の高血清濃度、リポタンパク質の高血清濃度、ホモシステインの高血清濃度、低密度リポタンパク質(LDL)-コレステロールの高血清濃度、リポタンパク質関連ホスホリパーゼ(A2)の高血清濃度、高密度リポ脂質(HDL)-コレステロールの低血清濃度、HDL(2b)-コレステロールの低血清濃度、アジポネクチンの低血清濃度、認知低下及び認知症から成る群より選択される状態を治療又は予防するための、請求項 1 ～ 17 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 19】

血圧がアンギオテンシンII受容体アンタゴニストによる治療又は前記アンギオテンシンII受容体アンタゴニストと低用量の利尿薬HCTZの併用では十分に制御されない患者の高血圧を治療するための、アンギオテンシンII受容体アンタゴニストテルミサルタンと利尿薬ヒドロクロロチアジドとを含む医薬単位剤形であって、前記テルミサルタンとヒドロクロロチアジドの質量比が、約80mgのテルミサルタンと約25mgのヒドロクロロチアジドの一日用量で前記患者を治療するのを可能にする、前記医薬単位剤形の製造方法。

【請求項 20】

前記剤形が、約80mgのテルミサルタンと約25mgのヒドロクロロチアジドを含む、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 21】

前記剤形が、約40mgのテルミサルタンと約12.5mgのヒドロクロロチアジドを含む、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 22】

前記剤形が、約160mgのテルミサルタンと約50mgのヒドロクロロチアジドを含み、かつ半分に分割できる、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 23】

請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物の製造のための、テルミサルタンとHCTZの使用。