

【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17年3月17日(2005.3.17)

【公開番号】特開2003-231634(P2003-231634A)

【公開日】平成15年8月19日(2003.8.19)

【出願番号】特願2003-14987(P2003-14987)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 31/549

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/28

【F I】

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 31/549

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/28

【手続補正書】

【提出日】平成16年4月12日(2004.4.12)

**【手続補正1】**

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

**【補正の内容】**

【特許請求の範囲】

**【請求項1】**

a) バルサルタンもしくは薬学的に許容されるその塩の有効量を含む、固体経口剤形の全重量に対し35重量%以上の活性成分；および

b) 崩壊剤を2から20重量%含む、固体経口剤形の製造に適当な薬学的に許容される添加剤；

を含有する、圧縮固体経口剤。

**【請求項2】**

活性成分が40から65重量%存在する、請求項1に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項3】**

活性成分が45から65重量%存在する、請求項1に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項4】**

活性成分が50重量%以上存在する、請求項1に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項5】**

バルサルタンが単位用量中で40mg、80mg、または160mg存在する、請求項1に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項6】**

活性成分として、さらにヒドロクロロチアジド(HCTZ)を含む、請求項1に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項7】**

バルサルタンが1回用量中で10から250mgの範囲で存在し、かつHCTZが1回用量中で6から60mgの範囲で存在する、請求項6に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項8】**

バルサルタンが単位用量中で10から250mgの間で存在し、かつHCTZが単位用量中で6から60mgの間で存在する、請求項7に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項9】**

バルサルタンが単位用量中で80mgまたは160mg存在し、かつHCTZが単位用量中で12.5mg存在する、請求項7に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項10】**

バルサルタンが単位用量中で80mg存在し、かつHCTZが単位用量中で12.5mgもしくは25mg存在するか、またはバルサルタンが単位用量中で160mg存在し、かつHCTZが単位用量中で12.5mgもしくは25mg存在する、請求項7に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項11】**

崩壊剤が、CMC-Ca、CMC-Na、架橋PVP、アルギン酸、アルギン酸ナトリウム、グアールガム、架橋CMC、およびAc-Di-Solを含む群から選択される、請求項1から10の何れか1つに記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項12】**

崩壊剤がクロスポビドン(crospovidone)である、請求項11に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項13】**

崩壊剤が架橋PVPである、請求項6から11の何れか1つに記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項14】**

架橋PVPが、10から20重量%の範囲で存在する、請求項13に記載の圧縮固体経口剤。

**【請求項15】**

添加剤が結合剤を含む、請求項 1 から 10 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 16】

結合剤が、ジャガイモのデンプン、小麦のデンプン、およびトウモロコシのデンプンのようなデンプン、微晶質セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、および ヒドロキシプロピルメチルセルロースからなる群から選択される、請求項 15 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 17】

結合剤が 10 から 45 重量 % の範囲で存在する、請求項 15 または 16 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 18】

結合剤が 20 から 30 重量 % の範囲で存在する、請求項 17 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 19】

結合剤が微晶質セルロースである、請求項 1 から 10 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 20】

結合剤が 20 から 30 重量 % の範囲で存在する、請求項 1 から 5 および 19 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 21】

微晶質セルロースが 10 から 30 重量 % の範囲で存在する、請求項 6 から 10 および 19 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 22】

添加剤が滑り剤 (glidant) を含む、請求項 1 から 10 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 23】

滑り剤が、コロイド状シリカ、三ケイ酸マグネシウム、顆粒セルロース、デンプン、タルク、および 3 塩基性リン酸カルシウムからなる群から選択される、請求項 22 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 24】

滑り剤がコロイド状シリカである、請求項 22 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 25】

滑り剤が 0.1 から 5 重量 % 存在する、請求項 22 から 24 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 26】

添加剤が潤沢剤を含む、請求項 1 から 10 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 27】

潤沢剤が、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸アルミニウム、ステアリン酸カルシウム、PEG 4000 - 8000、およびタルクからなる群から選択される、請求項 26 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 28】

潤沢剤がステアリン酸マグネシウムである、請求項 26 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 29】

ステアリン酸マグネシウムが 1 から 5 重量 % 存在する、請求項 26 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 30】

添加剤が充填剤もしくは希釈剤を含む、請求項 1 から 10 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 31】

充填剤もしくは希釈剤が、粉砂糖、圧縮糖 (compressible sugar)、デキストレート、デキストリン、デキストロース、ラクトース、マンニトール、マイクロセルロース、顆粒セルロース、ソルビトール、スクロース、およびタルクからなる群から選択される、請求項 3

0に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 3 2】

充填剤もしくは希釈剤が、微晶質セルロース Avicel である、請求項 3 1 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 3 3】

充填剤もしくは希釈剤が 15 から 40 重量 % の範囲で存在する、請求項 3 2 に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 3 4】

実施例 1 から 3 の何れか 1つ に記載の圧縮固体経口剤。

【請求項 3 5】

高血圧(悪性、本態性、腎-血管性、糖尿病性、単独収縮期もしくは他の2次型)、鬱血性心不全、アンギナ(安定性もしくは不安定性の何れか)、心筋梗塞、動脈硬化症(atherosclerosis)、糖尿病性腎障害、糖尿病性心筋疾患、腎機能不全、末梢性血管疾患、左心室肥大、認識機能不全、アルツハイマー病、ストローク、頭痛および慢性心不全から選択される疾患の処置に使用する、請求項 1~33 の何れか 1 つに記載の圧縮固体経口剤。