

【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 29 年 4 月 13 日 (2017.4.13)

【公表番号】特表 2016-515624 (P2016-515624A)

【公表日】平成 28 年 5 月 30 日 (2016.5.30)

【年通号数】公開・登録公報 2016-033

【出願番号】特願 2016-506615 (P2016-506615)

【国際特許分類】

A 6 1 K 33/24 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/12 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/585 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 33/24

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 7/12

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 9/04

A 6 1 K 31/585

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 29 年 3 月 7 日 (2017.3.7)

【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

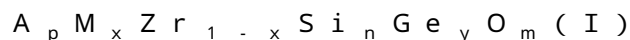
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

個々の医薬品用量で必要とする患者に投与される、慢性腎臓病を治療するための医薬組成物であって、式 (I) :



で表され、

式中、A はカリウムイオン、ナトリウムイオン、ルビジウムイオン、セシウムイオン、カルシウムイオン、マグネシウムイオン、ヒドロニウムイオン、またはこれらの混合物であり、

M は少なくとも 1 種の骨格金属であって、該骨格金属はハフニウム (4⁺)、ズ (4⁺)、ニオブ (5⁺)、チタン (4⁺)、セリウム (4⁺)、ゲルマニウム (4⁺)、プラセオジウム (4⁺)、テルビウム (4⁺)、またはこれらの混合物であり、

「p」は 1 から 20 の値を有し、

「x」は 0 から 1 未満の値を有し、

「n」は 1 から 12 の値を有し、

「y」は 0 から 12 の値を有し、

「m」は 3 から 36 の値を有し、及び、 $1 \leq n + y \leq 12$ である、

ケイ酸ジルコニウムを含有する、医薬組成物。

【請求項 2】

利尿剤との併用で患者に投与される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

該利尿剤が、ループ系利尿剤、チアジン利尿剤、カリウム保持性利尿剤、またはこれらの組み合わせである、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

該カリウム保持性利尿剤が、スピロノラクトン、エプレレノン、カンレノン、アミロリド、トリウムテレン、ベンザミル、またはこれらの薬学的に許容される塩である、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

該利尿剤が、慢性腎臓病または慢性心不全の治療のための進行中の治療の一部として投与される、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

該進行中の治療が、アンジオテンシン変換酵素（ACE）阻害薬またはアンジオテンシン受容体遮断（ARB）による治療を含む、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

該ケイ酸ジルコニウムが 3 ミクロン超の中央粒径を有し、該組成物中直径が 3 ミクロン未満である粒子は 7 % 未満であり、該組成物のナトリウム含有量は 12 重量 % 未満である、請求項 1 乃至 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

ナトリウム含有量が 0.05 重量 % から 3 重量 % である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

ナトリウム含有量が 0.01 重量 % 未満である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

該組成物中、直径が 3 ミクロン未満である粒子が 4 % 未満である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

該組成物中、直径が 3 ミクロン未満である粒子が 1 % 未満である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

該中央粒径が 5 ミクロンから 1000 ミクロンの範囲である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

該中央粒径が 20 ミクロンから 100 ミクロンの範囲である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

該ケイ酸ジルコニウムが、少なくとも、2.7 オングストロームから 3.5 オングストロームの範囲内にあり少なくとも第一の強度値を有する第一の d 間隔、5.3 から 6.1 の範囲内にあり該第一の強度値より小さい第二の強度値を有する第二の d 間隔、1.6 オングストロームから 2.4 オングストロームの範囲内にあり第三の強度値を有する第三の d 間隔、2.0 オングストロームから 2.8 オングストロームの範囲内にあり第四の強度値を有する第四の d 間隔、及び 5.9 オングストロームから 6.7 オングストロームの範囲内にあり第五の強度値を有する第五の d 間隔、の d 間隔値を有し、該第三の強度値、該第四の強度値、及び該第五の強度値がそれぞれ該第一の強度値及び該第二の強度値より小さい、X 線粉末回折スペクトルを示す、請求項 1 乃至 13 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

該用量が 8 g から 12 g の範囲内である、請求項 1 乃至 14 のいずれか一項に記載の医

薬組成物。

【請求項 16】

該用量が 10 g である、請求項 15 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

該ケイ酸ジルコニウムが 2.8 meq / g 超の陽イオン交換能を示す、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

該陽イオン交換能が 2.8 meq / g から 3.5 meq / g である、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

該ケイ酸ジルコニウムが 3 ミクロン超の中央粒径を有し、該組成物中直径が 3 ミクロン未満である粒子は 7 % 未満であり、該組成物のナトリウム含有量が 12 重量 % 未満である、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

該ケイ酸ジルコニウムが、少なくとも、2.7 オングストロームから 3.5 オングストロームの範囲内にあり少なくとも第一の強度値を有する第一の d 間隔、5.3 から 6.1 の範囲内にあり該第一の強度値より小さい第二の強度値を有する第二の d 間隔、1.6 オングストロームから 2.4 オングストロームの範囲内にあり第三の強度値を有する第三の d 間隔、2.0 オングストロームから 2.8 オングストロームの範囲内にあり第四の強度値を有する第四の d 間隔、及び 5.9 オングストロームから 6.7 オングストロームの範囲内にあり第五の強度値を有する第五の d 間隔、の d 間隔値を有し、該第三の強度値、該第四の強度値、及び該第五の強度値がそれぞれ該第一の強度値及び該第二の強度値より小さい、X 線粉末回折スペクトルを示す、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

該ケイ酸ジルコニウムが 2.8 meq / g 超のカリウム交換能を有する、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

該ケイ酸ジルコニウムが 2.8 meq / g から 3.5 meq / g のカリウム交換能を有する、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

該ケイ酸ジルコニウムが 3.05 meq / g から 3.35 meq / g のカリウム交換能を有する、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

該ケイ酸ジルコニウムが 3 ミクロン超の中央粒径を有し、該組成物中直径が 3 ミクロン未満である粒子は 7 % 未満であり、該組成物のナトリウム含有量が 12 重量 % 未満である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

ZS - 9 及び ZS - 7 を含み、検出可能な量の ZS - 8 を含まない、請求項 1 乃至 24 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

該 ZS - 9 が以下：

【表 1】

d(Å)	I
5.9-6.7	m
5.3-6.1	m-s
2.7-3.5	vs
2.0-2.8	w-m
1.6-2.4	w

の X 線回折パターンを有する、請求項 25 に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

該 ZS - 7 が以下：

【表 2】

d(Å)	I
6.8-7.6	vs
5.6-6.4	m
3.7-4.5	m
3.6-4.4	m
2.6-3.4	s-vs
2.5-3.3	m
2.4-3.2	vs

の X 線回折パターンを有する、請求項 25 に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

該 ZS - 8 が以下：

【表 3】

d(Å)	I
12.0-13.2	vs
3.9-4.7	m
2.8-3.6	m
2.3-3.1	m
2.2-3.0	w
2.1-2.9	w

の X 線回折パターンを有する、請求項 25 に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

該組成物が、50重量%から75重量%の範囲内でZS - 9を含む、請求項25に医薬組成物。

【請求項 30】

該組成物が、25重量%から50重量%の範囲内でZS-7を含む、請求項25に医薬組成物。

【請求項 31】

該ZS-9が3ミクロン超の中央粒径を有し、該組成物中直径が3ミクロン未満である粒子は7%未満であり、該組成物のナトリウム含有量が12重量%未満である、請求項25に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

該ZS-9が部分的にプロトン化されている、請求項25に記載の医薬組成物。

【請求項 33】

該プロトン化ZS-9が、3.1 meq/g超のカリウム交換率を有する、請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

該プロトン化ZS-9が、3.2 meq/gから3.5 meq/gの範囲内のカリウム交換率を有する、請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項 35】

該プロトン化ZS-9が、3.2 meq/gのカリウム交換率を有する、請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項 36】

該プロトン化ZS-9のナトリウム含有量が12%未満である、請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項 37】

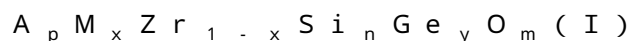
該ケイ酸ジルコニウムが、50重量%から75重量%の範囲内でZS-9を含み、25重量%から50重量%の範囲内でZS-7を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 38】

該患者がまた慢性心臓病と診断されている、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 39】

個々の医薬品用量で必要とする患者に投与される、慢性心臓病を治療するための医薬組成物であって、式(I)：



で表され、

式中、Aはカリウムイオン、ナトリウムイオン、ルビジウムイオン、セシウムイオン、カルシウムイオン、マグネシウムイオン、ヒドロニウムイオン、またはこれらの混合物であり、

Mは少なくとも1種の骨格金属であって、該骨格金属はハフニウム(4⁺)、ズ(4⁺)、ニオブ(5⁺)、チタン(4⁺)、セリウム(4⁺)、ゲルマニウム(4⁺)、プラセオジム(4⁺)、テルビウム(4⁺)、またはこれらの混合物であり、

「p」は1から20の値を有し、

「x」は0から1未満の値を有し、

「n」は1から12の値を有し、

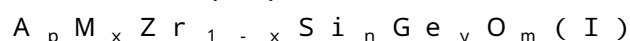
「y」は0から12の値を有し、

「m」は3から36の値を有し、及び、 $1 \leq n + y \leq 12$ である、

ケイ酸ジルコニウムを含有する、医薬組成物。

【請求項 40】

個々の医薬品用量で必要とする患者に投与される、アルドステロンを低下させるための医薬組成物であって、式(I)：



で表され、

式中、Aはカリウムイオン、ナトリウムイオン、ルビジウムイオン、セシウムイオン、カルシウムイオン、マグネシウムイオン、ヒドロニウムイオン、またはこれらの混合物

であり、

Mは少なくとも1種の骨格金属であって、該骨格金属はハフニウム(4⁺)、スズ(4⁺)、ニオブ(5⁺)、チタン(4⁺)、セリウム(4⁺)、ゲルマニウム(4⁺)、プラセオジウム(4⁺)、テルビウム(4⁺)、またはこれらの混合物であり、

「p」は1から20の値を有し、

「x」は0から1未満の値を有し、

「n」は1から12の値を有し、

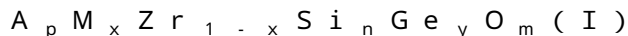
「y」は0から12の値を有し、

「m」は3から36の値を有し、及び、 $1 \leq n + y \leq 12$ である、

ケイ酸ジルコニウムを含有する、医薬組成物。

【請求項41】

個々の医薬品用量で必要とする患者に投与される、高リン血症を治療するための医薬組成物であって、式(I)：



で表され、

式中、Aはカリウムイオン、ナトリウムイオン、ルビジウムイオン、セシウムイオン、カルシウムイオン、マグネシウムイオン、ヒドロニウムイオン、またはこれらの混合物であり、

Mは少なくとも1種の骨格金属であって、該骨格金属はハフニウム(4⁺)、スズ(4⁺)、ニオブ(5⁺)、チタン(4⁺)、セリウム(4⁺)、ゲルマニウム(4⁺)、プラセオジウム(4⁺)、テルビウム(4⁺)、またはこれらの混合物であり、

「p」は1から20の値を有し、

「x」は0から1未満の値を有し、

「n」は1から12の値を有し、

「y」は0から12の値を有し、

「m」は3から36の値を有し、及び、 $1 \leq n + y \leq 12$ である、

ケイ酸ジルコニウムを含有する、医薬組成物。

【請求項42】

アンジオテンシン変換酵素(ACE)阻害薬またはアンジオテンシン受容体阻害薬(ARB)から選択される第一の薬剤との併用で患者に投与される、請求項1または請求項39に記載の医薬組成物。

【請求項43】

該第一の薬剤が、カプトプリル、ゾフェノプリル、エナラプリル、ラミプリル、キナプリル、ペリンドプリル、リジノプリル、ベナゼプリル、イミダプリル、ゾフェノプリル、トランドラプリル、ホシノプリル、またはこれらの薬学的に許容される塩から選択されるACE阻害薬である、請求項42に記載の医薬組成物。

【請求項44】

該第一の薬剤が、バルサルタン、テルミサルタン、ロサルタン、イルベサルタン、アジルサルタン、オルメサルタン、またはこれらの薬学的に許容される塩から選択されるARBである、請求項42に記載の医薬組成物。

【請求項45】

ACE阻害薬及びARBとの併用で患者に投与される、請求項1または請求項39に記載の医薬組成物。

【請求項46】

テルミサルタン及びラミプリルとの併用で患者に投与される、請求項1または請求項39に記載の医薬組成物。

【請求項47】

アルドステロン拮抗薬を含む第一の薬剤との併用で患者に投与される、請求項1または請求項39に記載の医薬組成物。

【請求項48】

該アルドステロン拮抗薬が、スピロノラクトン、エプレレノン、カンレノン、プロレノン、メクスレノン、またはこれらの薬学的に許容される塩から選択される、請求項４７に記載の医薬組成物。