

【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3月31日(2016.3.31)

【公表番号】特表2015-511241(P2015-511241A)

【公表日】平成27年4月16日(2015.4.16)

【年通号数】公開・登録公報2015-025

【出願番号】特願2014-558094(P2014-558094)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/12

A 6 1 P 7/02

【手続補正書】

【提出日】平成28年2月12日(2016.2.12)

【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】

少なくとも2種類の粒子の混合物であって、a)前記第1の種類の粒子が遊離塩基の形態またはその薬学的に許容される塩、多形、溶媒和物もしくは水和物の形態のダビガトランエキシラートを含んでなり、かつb)前記第2の種類の粒子が少なくとも1種の薬学的に許容される有機酸を含んでなることを特徴とする、組成物。

【請求項2】

少なくとも1種の粒子が、保護コーティング層がコートされたものである、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤をさらに含んでなる、請求項1および2のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項4】

前記第1の種類の粒子が酸を含まないものである、請求項1～3のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項5】

前記第2の種類の粒子がダビガトランエキシラートを含まないものである、請求項1～4のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項6】

0.01重量%～90重量%のダビガトランエキシラート(ダビガトランエキシラートメシラートとして)を含んでなる、請求項1～5のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項7】

前記組成物中の前記有機酸の少なくとも 90 重量 % が前記第 2 の種類の粒子に含有され、前記有機酸の残りがある場合には当該有機酸の残りが前記薬学的に許容される賦形剤の一部分を形成する、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 8】

前記第 1 の種類の粒子が、保護コーティング層がコートされたものである、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 9】

前記第 2 の種類の粒子が、保護コーティング層がコートされたものである、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 10】

前記少なくとも 1 種の薬学的に許容される有機酸を 2 重量 % ~ 95 重量 % 含んでなる、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 11】

前記組成物中の前記有機酸の少なくとも 90 重量 % が前記第 2 の種類の粒子に含有され、前記有機酸の残りがある場合には当該有機酸の残りが前記賦形剤の一部分を形成する、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 12】

ダビガトランエテキシラート 50 mg ~ 200 mg を含んでなる、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の組成物から調製された単位剤形。

【請求項 13】

非弁膜症性心房細動を患う患者における脳卒中および全身性塞栓症リスクの減少、および/または選択的人工股関節全置換手術または人工膝関節全置換手術を受けた成人患者における静脈血栓塞栓イベントの予防に使用される、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の組成物または請求項 12 に記載の単位剤型。

【請求項 14】

非弁膜症性心房細動を患う患者における脳卒中および全身性塞栓症リスクの減少、および/または選択的人工股関節全置換手術または人工膝関節全置換手術を受けた成人患者における静脈血栓塞栓イベントを予防するための薬剤の調製のための、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の組成物または請求項 12 に記載の単位剤型の使用。

【請求項 15】

非弁膜症性心房細動を患う患者における脳卒中および全身性塞栓症リスクの減少、および/または選択的人工股関節全置換手術または人工膝関節全置換手術を受けた成人患者における静脈血栓塞栓イベントを予防するための方法であって、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の組成物または請求項 12 に記載の単位剤型を、それを必要としている対象に投与することを含んでなる、方法。

【請求項 16】

前記第 1 の種類の粒子と、前記第 2 の種類の粒子とを、少なくとも 1 種の薬学的に許容される賦形剤とともに混合する工程を含んでなる、請求項 3 ~ 11 のいずれか一項に記載の組成物の調製方法。

【請求項 17】

前記第 1 の種類の粒子が造粒により調製されたものである、請求項 16 に記載の方法。

【請求項 18】

(i) 遊離塩基の形態またはその薬学的に許容される塩、多形、溶媒和物もしくは水和物の形態のダビガトランエテキシラートと、少なくとも 1 種の薬学的に許容される賦形剤とを配合する工程と、

(i i) 前記工程 (i) で得た配合物をバインダー溶液で造粒して、ダビガトランエテキシラートの顆粒を形成する工程と、

(i i i) 少なくとも 1 種の有機酸と、少なくとも 1 種の薬学的に許容される賦形剤とを配合する工程と、

(i v) 前記工程 (i i i) で得た配合物をバインダー溶液で造粒して、有機酸顆粒を

形成する工程と、

- (v) 前記有機酸顆粒に保護コーティング層をコートする工程と、
- (vi) 前記工程(iii)で得た顆粒を前記工程(v)で得たコートされた顆粒と配合して、少なくとも2種類の顆粒の混合物を形成する工程と、
(vii) 場合によって、前記工程(vi)で得られた少なくとも2種類の顆粒の混合物を、少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤と配合する工程と、
(viii) 前記工程(vii)で得た配合物に滑剤を添加する工程と、
(ix) 前記工程(viii)で得た潤滑混合物を好適な硬カプセルに充填する工程とを含んでなる、請求項17に記載の方法。

【請求項19】

- (i) 遊離塩基の形態またはその薬学的に許容される塩、多形、溶媒和物もしくは水和物の形態のダビガトランエテキシラートと、少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤とを配合する工程と、
(ii) 前記工程(i)で得た配合物をバインダー溶液で造粒して、ダビガトランエテキシラートの顆粒を形成する工程と、
(iii) 少なくとも1種の有機酸と、少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤とを配合する工程と、
(iv) 前記工程(iii)で得た配合物をバインダー溶液で造粒して、有機酸顆粒を形成する工程と、
(v) 前記ダビガトランエテキシラートの顆粒に保護コーティング層をコートする工程と、

- (vi) 前記工程(iv)で得た顆粒を前記工程(v)で得たコートされた顆粒と配合して、少なくとも2種類の顆粒の混合物を形成する工程と、
(vii) 場合によって、前記工程(vi)で得られた少なくとも2種類の顆粒の混合物を、少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤と配合する工程と、
(viii) 前記工程(vii)で得た配合物に滑剤を添加する工程と、
(ix) 前記工程(viii)で得た潤滑混合物を好適な硬カプセルに充填する工程とを含んでなる、請求項17に記載の方法。

【請求項20】

- (i) 遊離塩基の形態またはその薬学的に許容される塩、多形、溶媒和物もしくは水和物の形態のダビガトランエテキシラートと少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤とを配合する工程と、
(ii) 前記工程(i)で得た配合物をバインダー溶液で造粒して、ダビガトランエテキシラートの顆粒を形成する工程と、
(iii) 少なくとも1種の有機酸と、少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤とを配合する工程と、
(iv) 前記工程(iii)で得た配合物を押し出しおよび球形化して、有機酸ペレットを形成する工程と、
(v) 前記工程(iv)の有機酸ペレットに保護コーティング層をコートする工程と、
(vi) 前記工程(ii)で得た顆粒を前記工程(v)で得たコートされたペレットと配合して、少なくとも2種類の顆粒の混合物を形成する工程と、
(vii) 場合によって、前記工程(vi)で得られた少なくとも2種類の顆粒の混合物を、少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤と配合する工程と、
(viii) 前記工程(vii)で得た配合物に滑剤を添加する工程と、
(ix) 前記工程(viii)で得た潤滑混合物を好適な硬カプセルに充填する工程とを含んでなる、請求項17に記載の方法。