

【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22年10月28日 (2010.10.28)

【公表番号】特表2010-502762(P2010-502762A)

【公表日】平成22年1月28日 (2010.1.28)

【年通号数】公開・登録公報2010-004

【出願番号】特願2009-527796(P2009-527796)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 9/28

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月10日 (2010.9.10)

【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】

5 mm未満の直径を有し、ポリマー（類）のマトリックス内に治療上有効な量のファクター X a 阻害剤を含有する複数のミニ錠剤を含む、経口投与のためのモディファイされた放出医薬組成物。

【請求項 2】

ミニ錠剤が、4 . 5 mm未満の直径を有するところの、請求項 1 記載の、モディファイされた放出医薬組成物。

【請求項 3】

ミニ錠剤が、腸溶コートされているところの、請求項 1 ~ 2 のいずれか一項記載の、モディファイされた放出医薬組成物。

【請求項 4】

ポリマー（類）のマトリックスが 1 0 0 , 0 0 0 ダルトンから 8 0 0 , 0 0 0 ダルトンまでの分子量を有する 高分子量ポリマー（類）であるところの、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項記載のモディファイされた放出医薬組成物。

【請求項 5】

高分子量ポリマーが、H P M Cであるところの、請求項4記載のモディファイされた放出医薬組成物。

【請求項6】

ミニ錠剤が、カプセル以外の組成物の総重量に基づいて20%～60%のマトリックスポリマー（類）を含むところの、請求項1～5のいずれか一項記載の、モディファイされた放出医薬組成物。

【請求項7】

ミニ錠剤が、微結晶セルロースをさらに含むところの、請求1～6のいずれか一項記載の、モディファイされた放出医薬組成物。

【請求項8】

健常な成人のヒトへの単回経口量投与後の生体内最大血漿中濃度（ $C_{max}$ ）を示すファクターX a 阻害剤を含む、経口投与のためのモディファイされた放出医薬組成物であって、 $C_{max}$  GMRの絶食：給餌の比率が0.90～1.15の間にあるところの、医薬組成物。

【請求項9】

健常な成人のヒトへの単回経口量投与後の生体内曲線下面積（AUC）を示すファクターX a 阻害剤を含む、経口投与のためのモディファイされた放出医薬組成物であって、AUC GMRの絶食：給餌の比率が0.90～1.15の間にあるところの、医薬組成物。

【請求項10】

ファクターX a 阻害剤を含む経口投与のための請求項8または請求項9記載のモディファイされた放出医薬組成物であって、以下の特性：

- a)  $C_{max}$  GMRの絶食：給餌の比率が0.90～1.10の間にある、健常な成人のヒトへの単回経口量投与後の生体内最大血漿中濃度（ $C_{max}$ ）；および、
  - b) AUC GMRの絶食：給餌の比率が0.90～1.10の間にある、健常な成人のヒトへの単回経口量投与後の生体内曲線下面積（AUC）、
- のいずれか一方または両方により特徴づけられるところの、医薬組成物。

【請求項11】

ファクターX a 阻害剤が、(E)-2-(5-クロロチエン-2-イル)-N-{(3S)-1-[(1S)-1-メチル-2-モルホリン-4-イル-2-オキシエチル]-2-オキソピロリジン-3-イル}エテンスルホンアミドおよび/またはその医薬上許容される溶媒和物であるところの、請求項1～10のいずれか一項記載の、モディファイされた放出医薬組成物。

【請求項12】

各ミニ錠剤が、5mg～10mgのファクターX a 阻害剤を含むところの、請求項1～11のいずれか一項記載の、モディファイされた放出医薬組成物。

【請求項13】

ファクターX a 阻害剤による改善に影響されやすい状態をわずらう患者の処置のための医薬の製造のための、請求項1～12のいずれか一項記載の、モディファイされた放出医薬組成物。

【請求項14】

ファクターX a 阻害剤による改善に影響されやすい状態の処置に使用するための、請求項1～12のいずれか一項記載の、モディファイされた放出医薬組成物。

【請求項15】

請求項1～12のいずれか一項記載のモディファイされた放出医薬組成物を投与することを含む、ファクターX a 阻害剤による改善に影響されやすい状態を処置または予防する方法。