

【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】

5mm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Xa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、4.5mm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100,000ダルトンから800,000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($C_{m a x}$)を示すファクターXa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、 $C_{m a x}$ G M R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Xa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 G M R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Xa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) $C_{m a x}$ G M R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($C_{m a x}$)；および、
- b) AUC G M R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Xa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-オキソエチル]-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Xa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Xa阻害剤による改善に影響されやすい状態をわざ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Xa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Xa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。