

【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24年11月8日(2012.11.8)

【公表番号】特表2012-503665(P2012-503665A)

【公表日】平成24年2月9日(2012.2.9)

【年通号数】公開・登録公報2012-006

【出願番号】特願2011-529177(P2011-529177)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/165	(2006.01)
A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/41	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/165	
A 6 1 K	9/14	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	47/38	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/04	
A 6 1 K	31/41	
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	43/00	1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成24年9月19日(2012.9.19)

【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】

アリスキレンまたはその薬学的に許容される塩を、単独で、または別の活性薬剤と組み合わせて含む固体経口剤形であって、該アリスキレンまたはその薬学的に許容される塩が、任意選択で1種または複数の造粒用賦形剤と一緒に溶融造粒によって得られるものであり、前記溶融造粒は、押出物の温度が、少なくともアリスキレン又はその塩の少なくとも溶融温度、溶融範囲、軟化温度または軟化範囲である、あるいはより高い、押し出し法である、前記固体経口剤形。

【請求項 2】

押し出し法が、アリスキレン又はその塩のその非晶性形態への変換をもたらすものである、請求項 1 に記載の固体経口剤形。

【請求項 3】

アリスキレンが、1種または複数のポリマーと一緒に溶融造粒によって得られる、請求項1又は2に記載の固体経口剤形。

【請求項 4】

ポリマーが、N-ビニルピロリドンまたはセルロースのポリマーである、請求項3に記載の固体経口剤形。

【請求項 5】

ポリマーが、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、およびポリビニルピロリドンから選択される、請求項4に記載の固体経口剤形。

【請求項 6】

バルサルタンまたはその薬学的に許容される塩をさらに含む、請求項1から5のいずれかに記載の固体経口剤形。

【請求項 7】

アリスキレンまたはその薬学的に許容される塩が、バルサルタンまたはその薬学的に許容される塩から物理的に隔てられている、請求項6に記載の固体経口剤形。

【請求項 8】

アリスキレンまたはその薬学的に許容される塩を含む層、およびバルサルタンまたはその薬学的に許容される塩を含む層を含む二層錠剤の形態の、請求項6または7に記載の固体経口剤形。

【請求項 9】

高血圧、鬱血性心不全、狭心症、心筋梗塞、アテローム性動脈硬化症、糖尿病性腎症、糖尿病性心筋症、腎不全、末梢血管疾患、左心室肥大、認知機能不全、脳卒中、頭痛、および慢性心不全を治療するための、請求項1から8のいずれかに記載の固体経口剤形。

【請求項 10】

高血圧、鬱血性心不全、狭心症、心筋梗塞、アテローム性動脈硬化症、糖尿病性腎症、糖尿病性心筋症、腎不全、末梢血管疾患、左心室肥大、認知機能不全、脳卒中、頭痛、および慢性心不全を治療するための薬剤を製造するための、請求項1から9のいずれかに記載の固体経口剤形の使用。

【請求項 11】

アリスキレンまたはその薬学的に許容される塩と、任意選択の1種または複数の造粒用賦形剤とを溶融して押し出すステップ、薬学的に許容される添加物と任意選択で混合するステップ、ならびに最終ブレンドを任意選択で圧縮して錠剤にするステップを含む、請求項1から9のいずれか一項に記載の固体経口剤形の製造方法。

【請求項 12】

圧縮して錠剤にする前に、さらなる活性成分、例えば、バルサルタンの顆粒を添加するステップをさらに含む、請求項11に記載の方法。

【請求項 1 3】

(a') アリスキレンまたはその薬学的に許容される塩と、任意選択の 1 種または複数の造粒用賦形剤とを溶融して押し出してアリスキレン顆粒を形成するステップ、
(b') さらなる活性成分、例えば、バルサルタンを造粒するステップ、
(c') それぞれの顆粒を篩い分けるステップ、
(d') 任意選択で、それぞれの顆粒を外相用賦形剤と混合するステップ、および
(e') 双方の顆粒を一緒に圧縮して二層を形成するステップ
を含む、請求項 1 から 9 のいずれかに記載の固形経口剤形の製造方法。

【請求項 1 4】

(a) アリスキレンまたはその薬学的に許容される塩と、任意選択の 1 種または複数の造粒用賦形剤とをブレンドして、予備ブレンドされた材料を得るステップ、
(b) 予備ブレンドされた材料を篩い分け、篩い分けられた材料を得るステップ、
(c) 篩い分けられた材料をブレンドして、ブレンドされた材料を得るステップ、
(d) ブレンドされた材料を溶融して押し出して、押出物を得るステップ、
(c) 押出物を冷却するステップ、
(d) 冷却された押出物を粉碎するステップ、
(e) 任意選択で、粉碎された押出物を 1 種または複数の薬学的に許容される賦形剤とブレンドして、ブレンドされた最終材料を形成するステップ、
(f) 任意選択で、最終ブレンドを圧縮して錠剤を形成するステップ、および
(g) 任意選択で、フィルムコート錠剤を得るためにフィルム被覆を塗布するステップ、
を含む、請求項 1 1 から 1 3 のいずれか一項に記載の方法。