

【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26年6月19日(2014.6.19)

【公開番号】特開2014-5302(P2014-5302A)

【公開日】平成26年1月16日(2014.1.16)

【年通号数】公開・登録公報2014-002

【出願番号】特願2013-212550(P2013-212550)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/4152	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 P	7/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	41/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/16	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	9/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/4152			
A 6 1 K	9/20			
A 6 1 P	7/04			
A 6 1 P	43/00	1 1 1		
A 6 1 P	43/00	1 2 1		
A 6 1 K	41/00			
A 6 1 K	9/48			
A 6 1 K	9/16			
A 6 1 K	47/26			
A 6 1 K	9/24			
A 6 1 K	47/10			
A 6 1 K	47/32			
A 6 1 K	47/38			
A 6 1 K	47/36			
A 6 1 K	47/12			

【手続補正書】

【提出日】平成26年4月25日(2014.4.25)

【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】

a ) 3 ' - [ ( 2 Z ) - [ 1 - ( 3 , 4 -ジメチルフェニル ) - 1 , 5 -ジヒドロ - 3

-メチル-5-オキソ-4H-ピラゾール-4-イリデン]ヒドラジノ]-2'-ヒドロキシ-[1,1'-ビフェニル]-3-カルボン酸ビス-(モノエタノールアミン)を含む医薬錠剤であって、ここで

b) 化合物の粒子の90%が10ミクロンより大きいが、90ミクロンより小さい粒径を有し;

c) 結晶セルロース、粉末セルロース、アルファ化デンプン、デンプン、ラクチトール、マンニトール、ソルビトールおよびマルトデキストリンからなる群より選択される一または複数の賦形剤を25重量%~89重量%にて含有し;

d) フィルムコーティングされ;

e) 4重量%と等しいかまたはそれより多い量の崩壊剤を含有し;

f) 8重量%までの量の結合剤を含有してもよく;

g) 2重量%までの量の潤滑剤を含有してもよい、医薬錠剤。

#### 【請求項2】

結晶セルロースおよびマンニトールからなる群より選択される一または複数の賦形剤を25重量%~89重量%にて含有する、請求項1記載の医薬錠剤。

#### 【請求項3】

3'-(2Z)-[1-(3,4-ジメチルフェニル)-1,5-ジヒドロ-3-メチル-5-オキソ-4H-ピラゾール-4-イリデン]ヒドラジノ]-2'-ヒドロキシ-[1,1'-ビフェニル]-3-カルボン酸ビス-(モノエタノールアミン)を含有する医薬錠剤を調製する方法であって、

a) 化合物の粒子の90%が10ミクロンより大きいが、90ミクロンより小さい粒径を有する、3'-(2Z)-[1-(3,4-ジメチルフェニル)-1,5-ジヒドロ-3-メチル-5-オキソ-4H-ピラゾール-4-イリデン]ヒドラジノ]-2'-ヒドロキシ-[1,1'-ビフェニル]-3-カルボン酸ビス-(モノエタノールアミン)の化合物と、

結晶セルロース、粉末セルロース、アルファ化デンプン、デンプン、ラクチトール、マンニトール、ソルビトールおよびマルトデキストリンからなる群より選択される一または複数の賦形剤と、

さらなる賦形剤と

を混合して混合物を形成し;

b) 該混合物を錠剤に圧縮し; および

c) フィルムコーティング剤を該錠剤に塗布する工程を含む方法であって、ただし、

各錠剤が結晶セルロース、粉末セルロース、アルファ化デンプン、デンプン、ラクチトール、マンニトール、ソルビトールおよびマルトデキストリンからなる群より選択される一または複数の賦形剤を25重量%~89重量%にて含有し;

各錠剤が4重量%と等しいかまたはそれより多い量の崩壊剤を含有し;

各錠剤が8重量%までの量の結合剤を含有してもよく;

各錠剤が2重量%までの量の潤滑剤を含有してもよい、

医薬錠剤の調製方法。

#### 【請求項4】

各錠剤が結晶セルロースおよびマンニトールからなる群より選択される一または複数の賦形剤を25重量%~89重量%にて含有する、請求項3記載の方法。

#### 【請求項5】

請求項1に記載の医薬錠剤を含む、血小板減少症の処置のための剤。

#### 【請求項6】

請求項2に記載の医薬錠剤を含む、血小板減少症の処置のための剤。

#### 【請求項7】

a) 3'-(2Z)-[1-(3,4-ジメチルフェニル)-1,5-ジヒドロ-3-メチル-5-オキソ-4H-ピラゾール-4-イリデン]ヒドラジノ]-2'-ヒドロ

キシ - [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - カルボン酸ビス - ( モノエタノールアミン ) を含む医薬錠剤であって、ここで

b ) 化合物の粒子の 90 % が 10 ミクロンより大きいが、90 ミクロンより小さい粒径を有し；

c ) 少なくとも 50000 個の錠剤を調製するのに適する規模にて製造され；

d ) 結晶セルロース、粉末セルロース、アルファ化デンプン、デンプン、ラクチトール、マンニトール、ソルビトールおよびマルトデキストリンからなる群より選択される一または複数の賦形剤を 25 重量 % ~ 89 重量 % にて含有し；

e ) フィルムコーティングされ；

f ) 4 重量 % と等しいかまたはそれより多い量の崩壊剤を含有し；

g ) 8 重量 % までの量の結合剤を含有してもよく；

h ) 2 重量 % までの量の潤滑剤を含有してもよい、医薬錠剤。

【請求項 8】

結晶セルロースおよびマンニトールからなる群より選択される一または複数の賦形剤を 25 重量 % ~ 89 重量 % にて含有する、請求項 7 に記載の医薬錠剤。

【請求項 9】

3' - [ ( 2 Z ) - [ 1 - ( 3 , 4 - ジメチルフェニル ) - 1 , 5 - ジヒドロ - 3 - メチル - 5 - オキソ - 4 H - ピラゾール - 4 - イリデン ] ヒドラジノ ] - 2 ' - ヒドロキシ - [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - カルボン酸ビス - ( モノエタノールアミン ) を含有する医薬錠剤を調製する方法であって、

a ) 化合物の粒子の 90 % が 10 ミクロンより大きいが、90 ミクロンより小さい粒径を有する、3' - [ ( 2 Z ) - [ 1 - ( 3 , 4 - ジメチルフェニル ) - 1 , 5 - ジヒドロ - 3 - メチル - 5 - オキソ - 4 H - ピラゾール - 4 - イリデン ] ヒドラジノ ] - 2 ' - ヒドロキシ - [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - カルボン酸ビス - ( モノエタノールアミン ) の化合物と、

結晶セルロース、粉末セルロース、アルファ化デンプン、デンプン、ラクチトール、マンニトール、ソルビトールおよびマルトデキストリンからなる群より選択される一または複数の賦形剤と、

さらなる賦形剤と  
を混合して混合物を形成し；

b ) 該混合物を錠剤に圧縮し；および

c ) フィルムコーティング剤を該錠剤に塗布する

工程を含む方法であって、ただし、

該方法が、少なくとも 50000 個の錠剤を調製するのに適する規模にて行われ；

各錠剤が結晶セルロース、粉末セルロース、アルファ化デンプン、デンプン、ラクチトール、マンニトール、ソルビトールおよびマルトデキストリンからなる群より選択される一または複数の賦形剤を 25 重量 % ~ 89 重量 % にて含有し；

各錠剤が 4 重量 % と等しいかまたはそれより多い量の崩壊剤を含有し；

各錠剤が 8 重量 % までの量の結合剤を含有してもよく；

各錠剤が 2 重量 % までの量の潤滑剤を含有してもよい、

医薬錠剤の調製方法。

【請求項 10】

各錠剤が結晶セルロースおよびマンニトールからなる群より選択される一または複数の賦形剤を 25 重量 % ~ 89 重量 % にて含有する、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

請求項 9 に記載の医薬錠剤を含む、血小板減少症の処置のための剤。

【請求項 12】

請求項 10 に記載の医薬錠剤を含む、血小板減少症の処置のための剤。

【請求項 13】

a ) 3' - [ ( 2 Z ) - [ 1 - ( 3 , 4 - ジメチルフェニル ) - 1 , 5 - ジヒドロ - 3

- メチル - 5 - オキソ - 4 H - ピラゾール - 4 - イリデン ] ヒドラジノ ] - 2 ' - ヒドロキシ - [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - カルボン酸ビス - ( モノエタノールアミン ) の化合物を含む医薬錠剤であって、ここで

b ) 化合物の粒子の 90 % が 10 ミクロンより大きいが、90 ミクロンより小さい粒径を有する、医薬錠剤。

**【請求項 1 4】**

3 ' - [ ( 2 Z ) - [ 1 - ( 3 , 4 - ジメチルフェニル ) - 1 , 5 - ジヒドロ - 3 - メチル - 5 - オキソ - 4 H - ピラゾール - 4 - イリデン ] ヒドラジノ ] - 2 ' - ヒドロキシ - [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - カルボン酸ビス - ( モノエタノールアミン ) を含む医薬錠剤を調製する方法であって、

a ) 化合物の粒子の 90 % が 10 ミクロンより大きいが、90 ミクロンより小さい粒径を有する、3 ' - [ ( 2 Z ) - [ 1 - ( 3 , 4 - ジメチルフェニル ) - 1 , 5 - ジヒドロ - 3 - メチル - 5 - オキソ - 4 H - ピラゾール - 4 - イリデン ] ヒドラジノ ] - 2 ' - ヒドロキシ - [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - カルボン酸ビス - ( モノエタノールアミン ) の化合物と、

ーまたは複数の賦形剤と  
を混合して混合物を形成し；および  
b ) 該混合物を錠剤に圧縮する  
工程を含む方法。

**【請求項 1 5】**

請求項 1 3 に記載の医薬錠剤を含む、血小板減少症の処置のための剤。