

【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20年7月17日 (2008.7.17)

【公表番号】特表2005-538104(P2005-538104A)

【公表日】平成17年12月15日 (2005.12.15)

【年通号数】公開・登録公報2005-049

【出願番号】特願2004-524692(P2004-524692)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/366 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/4418 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 31/22

A 6 1 K 31/366

A 6 1 K 31/397

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4418

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月29日(2008.5.29)

【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】

1 から 20 重量 % のコレステロール吸収阻害剤 ; 1 から 80 重量 % のシンバスタチン ; 0.01 から 2 重量 % の安定化剤の少なくとも一種 ; および 10 重量 % 以下のクエン酸を含む、医薬組成物であって、
ただし、アスコルビン酸を含まない前記医薬組成物。

【請求項 2】

クエン酸の重量 % が 0.1 から 1.25 % である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

クエン酸の重量 % が約 0.25 % である、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

安定化剤が、ブチル化ヒドロキシアニソール (BHA)、2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール (BHT)、没食子酸プロピル、エデト酸二ナトリウム、メタ重亜硫酸カルシウムおよびそれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 5】

安定化剤が、BHA、没食子酸プロピルおよびそれらの組み合わせから選択される、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

追加の安定化剤が、BHA と没食子酸プロピルの組み合わせである、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

BHA の重量 % が 0.01 から 0.05 % である、請求項 5 または 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

約 0.02 % の BHA を含む、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

没食子酸プロピルの重量 % が 0.2 % 以下である、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 10】

0.001 から 0.05 重量 % の没食子酸プロピルを含む、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

約 0.005 重量 % の没食子酸プロピルを含む、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

さらに 5 から 20 重量 % の微結晶セルロース ; 1 から 4 重量 % のヒドロキシプロピルメチルセルロース ; および 0.5 から 2 重量 % のステアリン酸マグネシウムを含む、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 13】

さらに 10 重量 % 以下のクロスカルメロースナトリウムを含む、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 14】

2 から 4 重量 % のクロスカルメロースナトリウムを含む、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

コレステロール吸収阻害剤がエゼチミブである、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載

の組成物。

【請求項 16】

1.25 から 10 % のエゼチミブ、および 1 から 20 % のシンバスタチンを含む、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

5 から 10 % のシンバスタチンを含む、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

アルファ化デンプンを含まない、請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 19】

経口用投薬単位の形態である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 20】

5 から 20 mg のエゼチミブ；5 から 80 mg のシンバスタチン；1 mg のシンバスタチン当たり、0.002 から 0.004 mg の BHA；および 80 mg 以下のクエン酸を含む、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

0.25 から 2 mg のクエン酸を含む、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 22】

10 mg のエゼチミブおよび 5 mg、10 mg、20 mg、40 mg および 80 mg から選択されるシンバスタチンの投薬量を含む、請求項 20 または 21 に記載の組成物。

【請求項 23】

1 mg のシンバスタチン当たり、0.0005 から 0.001 mg の没食子酸プロピルをさらに含む、請求項 20 から 22 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 24】

さらに 1 から 640 mg の微結晶セルロース；0.5 から 80 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロース；0.1 から 32 mg のステアリン酸マグネシウム；および 25 から 1000 mg のラクトースを含む、請求項 20 から 23 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 25】

15 から 120 mg の微結晶セルロース；2 から 16 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロース；および 1.5 から 12 mg のステアリン酸マグネシウムを含む、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 26】

さらに 80 mg 以下のクロスカルメロースナトリウムを含む、請求項 20 から 25 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 27】

フィルム被膜を有さない錠剤の形態である、請求項 19 から 26 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 28】

アルファ化デンプンを含まない、請求項 19 から 27 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 29】

10.0 mg シンバスタチン；
10.0 mg エゼチミブ；
15.0 mg 微結晶セルロース；
58.23 mg ラクトース；
2.0 mg HPMC；
3.0 mg クロスカルメロースナトリウム；
0.25 mg クエン酸；
0.005 mg 没食子酸プロピル；
0.02 mg BHA；および
1.5 mg ステアリン酸マグネシウム

から実質的に成る、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

20.0mg シンバスタチン；
10.0mg エゼチミブ；
30.0mg 微結晶セルロース；
126.45mg ラクト - ス；
4.0mg HPMC；
6.0mg クロスカルメロースナトリウム；
0.5mg クエン酸；
0.01mg 没食子酸プロピル；
0.04mg BHA；および
3.0mg ステアリン酸マグネシウム

から実質的に成る、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

40.0mg シンバスタチン；
10.0mg エゼチミブ；
60.0mg 微結晶セルロース；
262.90mg ラクト - ス；
8.0mg HPMC；
12.0mg クロスカルメロースナトリウム；
1.0mg クエン酸；
0.02mg 没食子酸プロピル；
0.08mg BHA；および
6.0mg ステアリン酸マグネシウム

から実質的に成る、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

80.0mg シンバスタチン；
10.0mg エゼチミブ；
120.0mg 微結晶セルロース；
535.84mg ラクト - ス；
16.0mg HPMC；
24.0mg クロスカルメロースナトリウム；
2.0mg クエン酸；
0.04mg 没食子酸プロピル；
0.16mg BHA；および
12.0mg ステアリン酸マグネシウム

から実質的に成る、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 33】

高脂血症の治療、もしくは心筋梗塞などのアテローム性動脈硬化症の治療または予防に使用するための、請求項 1 から 32 のいずれか一項に記載の組成物。