

【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21年4月2日(2009.4.2)

【公表番号】特表2008-534592(P2008-534592A)

【公表日】平成20年8月28日(2008.8.28)

【年通号数】公開・登録公報2008-034

【出願番号】特願2008-504152(P2008-504152)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/32 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/138

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/26

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/32

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 1/04

【手続補正書】

【提出日】平成21年2月13日(2009.2.13)

【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】

活性化化合物として O - デスメチルベンラファキシシン (O-desmethylenlafaxine) またはその医薬上許容される塩とバゼドキシフェンまたはその医薬上許容される塩とを含む組み合わせ生成物。

【請求項 2】

前記生成物は O - デスメチルベンラファキシシンスクシネートを含む、請求項 1 に記載の生成物。

【請求項 3】

前記生成物はバゼドキシフェンアセテートを含む、請求項 1 または 2 に記載の生成物。

【請求項 4】

錠剤を含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の生成物。

【請求項 5】

前記錠剤は多層錠であり、前記活性化化合物は個別層内に位置する、請求項 4 に記載の生成物。

【請求項 6】

前記バゼドキシフェンは、O - デスメチルベンラファキシシンコアを覆うコーティング層内に提供される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の生成物。

【請求項 7】

前記バゼドキシフェンは前記生成物の約 20 mg を構成する、請求項 6 に記載の生成物。

【請求項 8】

カプセル剤を含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の生成物。

【請求項 9】

O - デスメチルベンラファキシシン遊離塩基の量に基づいて、10 mg ~ 500 mg の O - デスメチルベンラファキシシンスクシネートを含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の生成物。

【請求項 10】

O - デスメチルベンラファキシシン遊離塩基の量に基づいて、150 mg の O - デスメチルベンラファキシシンスクシネートを含む、請求項 9 に記載の生成物。

【請求項 11】

バゼドキシフェンまたはその医薬上許容される塩を 5 mg ~ 100 mg の量で含む、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の生成物。

【請求項 12】

デスベンラファキシシンスクシネート、ヒポメロース (hypomellose)、微結晶セルロース、タルク、およびマグネシウムステアレートを含む第 1 層とバゼドキシフェンまたはその医薬上許容される塩を含む第 2 層とを含む錠剤。

【請求項 13】

前記第 2 層は、バゼドキシフェンアセテート、ラクトース、微結晶セルロース、およびデンプンを含む、請求項 12 に記載の錠剤。

【請求項 14】

前記第 1 層は：

45～55重量%のデスベンラファキシンスクシネート；

35～45重量%のヒポメロース；

3～4重量%の微結晶セルロース；

4～5重量%のタルク；および

1～2重量%のマグネシウムステアレートを含む10mg～500mgのデスベンラファキシンスクシネートの顆粒を含む、請求項12または13に記載の錠剤。

【請求項 15】

前記デスベンラファキシンスクシネートは約50%であり、前記ヒポメロースは約40重量%である、請求項12～14のいずれか一項に記載の錠剤。

【請求項 16】

前記第 2 層は：

10重量%のバゼドキシフェンアセテート；

30～35重量%のラクトース；

25～30重量%の微結晶セルロース；

12～16重量%の 化デンプン；

1～2重量%のナトリウム라우リルサルフェート；

5～8重量%のナトリウムデンプングリコレート；

1～2重量%のアスコルビン酸；

<1重量%のシリコンジオキシド；および

<1重量%のマグネシウムステアレートを含む5mg～100mgのバゼドキシフェンアセテートの顆粒を含む、請求項12～15のいずれか一項に記載の錠剤。

【請求項 17】

前記第 2 層は、40mgのバゼドキシフェンアセテートの顆粒を含む、請求項16に記載の錠剤。

【請求項 18】

前記第 2 層は、5mg～100mgのバゼドキシフェンと等価の量のバゼドキシフェンまたはその塩を有する固体分散体混合物を含む、請求項12に記載の錠剤。

【請求項 19】

前記バゼドキシフェンまたはその塩は、20mgの固体分散体混合物である、請求項18に記載の錠剤。

【請求項 20】

前記固体分散体混合物は：

約40重量%のバゼドキシフェン；ポリビニルピロリドン固体分散体；

約50重量%の微結晶セルロース；

約10重量%のクロスカルメロースナトリウム；および

約1重量%のマグネシウムステアレートを含む、請求項16に記載の錠剤。

【請求項 21】

前記バゼドキシフェンは、錠剤1錠当たり約20mgの量でコーティング層内に提供される、請求項12に記載の錠剤。

【請求項 22】

前記コーティング層は、バゼドキシフェンアセレートおよびヒポメロースを含む、請求項21に記載の錠剤。

【請求項 23】

デスベンラファキシンスクシネート多微粒子およびバゼドキシフェンまたはその医薬上許容される塩を含むカプセル剤。

【請求項 24】

前記バゼドキシフェンまたはその医薬上許容される塩は固体分散体の形状にある、請求項23に記載のカプセル剤。

【請求項 25】

前記バゼドキシフェンまたはその医薬上許容される塩は顆粒の形状にある、請求項 23 に記載のカプセル剤。

【請求項 26】

前記バゼドキシフェンは、多微粒子に塗布されるコーティングである、請求項 23 に記載のカプセル剤。

【請求項 27】

前記多微粒子は、デスベンラファキシンスクシネートおよび微結晶セルロースを含む、請求項 23 に記載のカプセル剤。

【請求項 28】

顔面潮紅、骨粗鬆症、および／または膣萎縮症の治療において有用な医薬品の調製における、請求項 1～27 のいずれか一項に記載の組み合わせ生成物の使用。

【請求項 29】

エストロゲンの低血中濃度を特徴とする障害の治療において有用な医薬品の調製における、請求項 1～27 のいずれか一項に記載の組み合わせ生成物の使用。

【請求項 30】

うつ病、線維筋痛症、不安、腹圧性尿失禁、および／または過敏性腸症候群の治療において有用な医薬品の調製における、請求項 1～27 のいずれか一項に記載の組み合わせ生成物の使用。

【請求項 31】

顔面潮紅、骨粗鬆症、および／または膣萎縮症；またはエストロゲンの低血中濃度を特徴とする障害；またはうつ病、線維筋痛症、不安、腹圧性尿失禁、および／または過敏性腸症候群を治療するための医薬品の調製における、O-デスメチルベンラファキシンもしくはその医薬上許容される塩またはバゼドキシフェンもしくはその医薬上許容される塩の使用。

【請求項 32】

顔面潮紅、骨粗鬆症、および／または膣萎縮症；またはエストロゲンの低血中濃度を特徴とする障害；またはうつ病、線維筋痛症、不安、腹圧性尿失禁、および／または過敏性腸症候群を治療するための医薬品の調製における、その治療がバゼドキシフェンまたはその医薬上許容される塩の投与もまた含む、O-デスメチルベンラファキシンまたはその医薬上許容される塩の使用。

【請求項 33】

顔面潮紅、骨粗鬆症、および／または膣萎縮症；またはエストロゲンの低血中濃度を特徴とする障害；またはうつ病、線維筋痛症、不安、腹圧性尿失禁、および／または過敏性腸症候群を治療するための医薬品の調製における、その治療がO-デスメチルベンラファキシンまたはその医薬上許容される塩の投与もまた含む、バゼドキシフェンまたはその医薬上許容される塩の使用。