

【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17年5月26日(2005.5.26)

【公表番号】特表2004-529893(P2004-529893A)

【公表日】平成16年9月30日(2004.9.30)

【年通号数】公開・登録公報2004-038

【出願番号】特願2002-569239(P2002-569239)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 43/00

【F I】

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成15年8月29日(2003.8.29)

【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】

薬剤として用いるための、メトクロプラミドを除くp-gp阻害剤と組み合わせたエレトリプタン。

【請求項2】

片頭痛の処置のための、メトクロプラミドを除くp-gp阻害剤と組み合わせた薬剤の製造におけるエレトリプタンの使用。

【請求項3】

メトクロプラミドを除くp-gp阻害剤を同時に受容する患者に投与するための、片頭痛の処置用薬剤の製造におけるエレトリプタンの使用。

【請求項4】

前記p-gp阻害剤が、p-gp阻害剤としての他には薬学的に活性でない請求項2または請求項3に記載の使用。

【請求項5】

前記p-gp阻害剤が、p-gp阻害剤としての他に薬学的にも活性である請求項2または請求項3に記載の使用。

【請求項6】

前記薬剤が、AUCによって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも25%増加させる請求項2~5のいずれか1項に記載の使用。

【請求項7】

前記薬剤が、AUCによって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも50%増加させる請求項2~5のいずれか1項に記載の使用。

**【請求項 8】**

前記薬剤が、AUCによって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して100%増加させる請求項2~5のいずれか1項に記載の使用。

**【請求項 9】**

前記薬剤が、C<sub>max</sub>によって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも50%増加させる請求項2~5のいずれか1項に記載の使用。

**【請求項 10】**

前記薬剤が、C<sub>max</sub>によって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも100%増加させる請求項2~5のいずれか1項に記載の使用。

**【請求項 11】**

前記薬剤が、C<sub>max</sub>によって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも200%増加させる請求項2~5のいずれか1項に記載の使用。

**【請求項 12】**

前記増加が血清中で測定される請求項6~11のいずれか1項に記載の使用。

**【請求項 13】**

前記薬剤が、50%を超える、AUCによって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを与える請求項1~12のいずれか1項に記載の使用。

**【請求項 14】**

前記薬剤が、片頭痛軽癒開始速度を、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも25%改善する請求項1または12に記載の使用。

**【請求項 15】**

エレトリプタン、メトクロプラミドを除くp-gp阻害剤および薬学的に許容しうる担体、希釈剤または賦形剤を含む医薬組成物。

**【請求項 16】**

前記p-gp阻害剤が、p-gp阻害剤としての他には薬学的に活性でない請求項15に記載の組成物。

**【請求項 17】**

前記p-gp阻害剤が薬学的にも活性である請求項15に記載の組成物。

**【請求項 18】**

AUCによって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも25%増加させる請求項15~17のいずれか1項に記載の組成物。

**【請求項 19】**

AUCによって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも50%増加させる請求項15~17のいずれか1項に記載の組成物。

**【請求項 20】**

AUCによって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して100%増加させる請求項15~17のいずれか1項に記載の組成物。

**【請求項 21】**

C<sub>max</sub>によって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-gp阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも50%増加させる請求項15~17のいずれか1項に記載の組成物。

**【請求項 22】**

C<sub>max</sub>によって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、p-

g p 阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも 100 % 増加させる請求項 15 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 23】

$C_{max}$  によって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーを、 p - g p 阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも 200 % 増加させる請求項 15 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 24】

前記増加が血清中で測定される請求項 18 ~ 23 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 25】

AUC によって測定されるエレトリプタンの経口バイオアベイラビリティーが 50 % を超える、請求項 15 ~ 24 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 26】

片頭痛軽癒開始速度を、 p - g p 阻害剤の不存在下の投薬に対して少なくとも 25 % 改善する請求項 15 ~ 23 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 27】

(1) 第一剤形中に、エレトリプタンおよび薬学的に許容しうる担体、希釈剤または賦形剤を含む治療的有効量の組成物；

(2) 第二剤形中に、 p - g p 阻害剤である化合物と、薬学的に許容しうる担体、希釈剤または賦形剤とを含む治療的有効量の組成物；および

(3) 該第一剤形および第二剤形を含有するための容器を含むキット。

【請求項 28】

p - g p 阻害剤がエリスロマイシンである、請求項 15 に記載の組成物。