

【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3月5日(2009.3.5)

【公表番号】特表2008-531594(P2008-531594A)

【公表日】平成20年8月14日(2008.8.14)

【年通号数】公開・登録公報2008-032

【出願番号】特願2007-557195(P2007-557195)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/27	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	15/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	9/16	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/27	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/20	
A 6 1 P	15/12	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/02	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/36	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	9/48	
A 6 1 K	9/14	
A 6 1 K	9/16	
A 6 1 P	43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年1月15日(2009.1.15)

【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】

R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N'-プロパルギル-1-アミノインダン1/2 タータラート、少なくとも1の薬学的に許容可能な賦形剤、および組成物の5重量%以下の水を含んでなる医薬組成物。

【請求項2】

2~5重量%の水を含んでなる、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

2~3.5重量%の水を含んでなる、請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N'-プロパルギル-1-アミノインダン1/2 タータラート、少なくとも1の薬学的に許容可能な賦形剤、および組成物の0.5重量%以下のステアリン酸マグネシウムを含んでなる医薬組成物。

【請求項5】

ステアリン酸マグネシウムを含まない、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項6】

R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N'-プロパルギル-1-アミノインダン1/2 タータラート、少なくとも1の薬学的に許容可能な賦形剤、および組成物の1.5重量%以下のナトリウムステアリルフマレートを含んでなる医薬組成物。

【請求項7】

組成物の0.5重量%以下のナトリウムステアリルフマレートを含んでなる、請求項6に記載の組成物。

【請求項8】

ナトリウムステアリルフマレートを含まない、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項9】

組成物の0.5%以下がステアリン酸マグネシウムである、請求項1~3または6~8のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項10】

ステアリン酸マグネシウムを含まない、請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項11】

組成物の0.5重量%以下がナトリウムステアリルフマレートである、請求項1~3、9、または10のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項12】

ナトリウムステアリルフマレートを含まない、請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項13】

組成物の0.5重量%以下がステアリン酸である、請求項1~12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項14】

ステアリン酸を含まない、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

前記少なくとも1の薬学的に許容可能な賦形剤が、第1の充填剤、第2の充填剤、崩壊剤、流動化剤、結合剤、または滑沢剤である、請求項1~12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項16】

前記滑沢剤がタルクである、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項17】

前記タルクが組成物の4重量%以下の量で存在する、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項18】

前記滑沢剤がステアリン酸をさらに含んでなる、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項19】

前記ステアリン酸が組成物の2重量%以下の量で存在する、請求項18に記載の医薬組成物。

【請求項20】

前記滑沢剤がステアリン酸である、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項21】

タルクを含まない、請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項22】

ステアリン酸を含まない、請求項15、16、または17のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項23】

前記第1の充填剤は、6~16重量%の量で存在するマンニトールであり、前記第2の充填剤は、0~56重量%の量で存在するマンニトール顆粒であり、前記崩壊剤は、15~38重量%の量で存在するデンプンであり、前記流動化剤は、1~2重量%の量で存在するコロイド性二酸化ケイ素であり、前記結合剤は、3~8重量%の量で存在するポリビニルピロリドンである、請求項15~22のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項24】

前記第1の充填剤は、6.6重量%の量で存在するマンニトールであり、前記第2の充填剤は、56.1重量%の量で存在するマンニトール顆粒であり、前記崩壊剤は、15.2重量%の量で存在するデンプンであり、前記流動化剤は、0.9重量%の量で存在するコロイド性二酸化ケイ素であり、前記結合剤は、3.4重量%の量で存在するポリビニルピロリドンであり、前記滑沢剤は、3.8重量%の量で存在するタルクおよび1.9重量%の量で存在するステアリン酸である、請求項15~19のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項25】

前記第1の充填剤は、16.4重量%の量で存在するマンニトールであり、前記崩壊剤は37.4重量%の量で存在するデンプンであり、前記流動化剤は、2.1重量%の量で存在するコロイド性二酸化ケイ素であり、前記結合剤は、8.4重量%の量で存在するポリビニルピロリドンであり、前記滑沢剤は、3.7重量%の量で存在するタルクおよび1.9重量%の量で存在するステアリン酸である、請求項15~19のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項26】

錠剤、カプセル剤、ピル、散剤、または顆粒剤の形態である、請求項1~25のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項27】

錠剤の形態である、請求項26に記載の医薬組成物。

【請求項28】

カプセル剤の形態である、請求項26に記載の医薬組成物。

【請求項29】

ヒトの患者に投与した場合に、R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N'-プロパルギル-1-アミノインダンの最高血漿中濃度が少なくとも0.7nmol/mlとなる、請求項1~27のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項30】

R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N'-プロパルギル-1-アミノインダン 1/2 タータラートおよび薬学的に許容可能なキャリアを含んでなる医薬組成物であつて、ヒトの患者に投与した場合に、R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N'-プロパルギル-1-アミノインダンの最高血漿中濃度が少なくとも0.7nmol/mlとなる組成

物。

【請求項 3 1】

投与してから12時間後に、ヒトの患者において、R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N' - プロパルギル-1-アミノインダンの血漿中濃度が少なくとも0.01nmol/mlとなるように配合される、請求項30に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

ヒトの患者において、R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N' - プロパルギル-1-アミノインダンの血漿中濃度が少なくとも1.88nmol/mlとなるように配合される、請求項30に記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

液体シンチレーションカウンティングにより測定する場合、ヒトの患者に対する投与において、59% ~ 91% のモノアミンオキシダーゼB阻害を示すように配合される、請求項30に記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

液体シンチレーションカウンティングにより測定する場合、ヒトの患者に対する投与において、75% のモノアミンオキシダーゼB阻害を示すように配合される、請求項33に記載の医薬組成物。

【請求項 3 5】

液体シンチレーションカウンティングにより測定する場合、ヒトの患者に対する投与において、28% ~ 86% の3,4-ジヒドロキシフェニルグリコール血漿中濃度の減少を示すように配合される、請求項30に記載の医薬組成物。

【請求項 3 6】

液体シンチレーションカウンティングにより測定する場合、ヒトの患者に対する投与において、57% の3,4-ジヒドロキシフェニルグリコール血漿中濃度の減少を示すように配合される、請求項35に記載の医薬組成物。

【請求項 3 7】

投与される医薬組成物が25 ~ 105mgのR(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N' - プロパルギル-1-アミノインダン 1/2 タータラートを含んでなる、請求項30 ~ 36のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 8】

1回の投与後に、ヒトの患者において、R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N' - プロパルギル-1-アミノインダンの最高血漿中濃度を少なくとも0.7nmol/mlとするための方法であって、R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N' - プロパルギル-1-アミノインダン 1/2 タータラートおよび薬学的に許容可能なキャリアを含んでなる固体の医薬組成物をヒトの患者に投与することにより、患者において前記血漿中濃度を誘導することを含んでなる方法。

【請求項 3 9】

投与してから12時間後のR(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N' - プロパルギル-1-アミノインダンの血漿中濃度が少なくとも0.01nmol/mlである、請求項38に記載の方法。

【請求項 4 0】

R(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N' - プロパルギル-1-アミノインダンの最高血漿中濃度が1.88nmol/mlである、請求項38または39に記載の方法。

【請求項 4 1】

投与された医薬組成物が25 ~ 105mgのR(+)-6-(N-メチル, N-エチル-カルバモイルオキシ)-N' - プロパルギル-1-アミノインダン 1/2 タータラートを含んでなる、請求項38 ~ 40のいずれか1項に記載の方法。

【請求項 4 2】

パーキンソン病、アルツハイマー病もしくは認知症、うつ病、または神経性の障害に苦しむ患者を治療する方法であって、請求項1 ~ 37のいずれか1項に記載の医薬組成物を患者

に投与することを含んでなる方法。

【請求項 4 3】

前記患者が神経性の障害で苦しんでおり、前記神経性の障害が、てんかん、ナルコレプシー、筋萎縮性側索硬化症(ALS)、記憶障害、パニック、心的外傷後ストレス症候群(PTSD)、性的な機能障害、注意欠陥過活動性障害(ADHD)、注意欠陥障害、またはツレット症候群である、請求項42に記載の方法。

【請求項 4 4】

前記患者が認知症に苦しんでおり、前記認知症が、静的な認知症、アルツハイマー型認知症、老年性認知症、初老期認知症、進行性認知症、血管性認知症、またはレーヴィ体認知症である、請求項42に記載の方法。

【請求項 4 5】

前記患者がアルツハイマー病に苦しんでいる、請求項42に記載の方法。

【請求項 4 6】

前記患者がパーキンソン病に苦しんでいる、請求項42に記載の方法。

【請求項 4 7】

湿式顆粒化のステップを含んでなる、請求項1～37のいずれか1項に記載の医薬組成物の製造方法。

【請求項 4 8】

水の添加をすることなく湿式顆粒化のステップを含んでなる、請求項47に記載の方法。

【請求項 4 9】

前記湿式顆粒化のステップがイソプロパノールの存在下で行われる、請求項47または48に記載の方法。

【請求項 5 0】

エタノールの非存在下で行われる、請求項47～49のいずれか1項に記載の方法。