

【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】令和2年9月24日(2020.9.24)

【公表番号】特表2019-535643(P2019-535643A)

【公表日】令和1年12月12日(2019.12.12)

【年通号数】公開・登録公報2019-050

【出願番号】特願2019-512895(P2019-512895)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|--------|-----------|
| C 0 7 C | 271/12 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/27 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 15/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 21/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/14 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/34 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/24 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/02 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/20 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/48 | (2006.01) |
| C 0 7 C | 269/08 | (2006.01) |

【F I】

| | | |
|---------|--------|-------|
| C 0 7 C | 271/12 | C S P |
| A 6 1 K | 31/27 | |
| A 6 1 P | 3/04 | |
| A 6 1 P | 15/10 | |
| A 6 1 P | 21/00 | |
| A 6 1 P | 25/14 | |
| A 6 1 P | 25/34 | |
| A 6 1 P | 25/00 | |
| A 6 1 P | 25/24 | |
| A 6 1 P | 3/02 | |
| A 6 1 K | 9/20 | |
| A 6 1 K | 9/48 | |
| C 0 7 C | 269/08 | |

【手続補正書】

【提出日】令和2年8月11日(2020.8.11)

【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】

図1のフォーム(form)Bに示されるものと実質的に同一の粉末X線回折パターン(powder x-ray diffraction pattern)及び/または約7.0、13.6、16.2、17.4、17.8、18.5、21.0、21.7、22.7、23.0、24.0、及び $27.3 \pm 0.2^{\circ}2$ でピークを有する粉末X線回

折パターンを特徴とする、(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩((R)-2-amino-3-phenylpropyl carbamate hydrochloride)の溶媒和物フォーム。

【請求項2】

示差走査熱量測定法(differential scanning calorimetry)により69.1の温度で開始し、71.7の温度でピークを有する広い吸熱(broad endotherm)、及び182.5の温度で開始し、183.6の温度でピークを有する急激な吸熱(sharp endotherm)を有することをさらなる特徴とする、請求項1に記載の(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の溶媒和物フォーム。

【請求項3】

溶媒和物フォームは半水和物(hemihydrate)である、請求項1または2に記載の(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の溶媒和物フォーム。

【請求項4】

アセトニトリル/水(95%/5% v/v)中で(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩をスラリー化して生産することをさらなる特徴とする、請求項1から3のいずれか一項に記載の(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の溶媒和物フォーム。

【請求項5】

アセトニトリル/水(95%/5% v/v)中で(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩をスラリー化する段階、及び真空ろ過(vacuum fil tration)で溶媒和物を収集する段階を含む、(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の溶媒和物フォームを製造する方法。

【請求項6】

スラリー化する段階は室温で行われる、請求項5に記載の(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の溶媒和物フォームを製造する方法。

【請求項7】

スラリー化する段階は、少なくとも約20時間行われる、請求項5または6に記載の(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の溶媒和物フォームを製造する方法。

【請求項8】

(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の少なくとも30%は、請求項1から4のいずれか一項に記載の溶媒和物フォームである、(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項9】

(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の10%未満が、請求項1から4のいずれか一項に記載の溶媒和物フォームである、(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項10】

組成物は剤形(dosage form)である、請求項8または9に記載の(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項11】

組成物は、即時放出経口剤形(immediate release oral dosage form)である、請求項10に記載の(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項12】

組成物は、錠剤(tablet)またはカプセルである、請求項11に記載の(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項13】

請求項 8 から 11 のいずれか一項の記載の組成物であって、それを必要とする対象のナルコレプシー (narcolepsy)、カタプレキシー (cataplexy)、日中の過剰な眠気 (excessive daytime sleepiness)、薬物中毒 (drug addiction)、性機能障害 (sexual dysfunction)、疲労 (fatigue)、纖維筋肉痛 (fibromyalgia)、注意欠陥 / 多動性障害 (attention deficit/hyperactivity disorder)、下肢静止不能症候群 (restless legs syndrome)、うつ病 (depression)、双極性障害 (bipolar disorder) または肥満を治療するか、或いはそれを必要とする対象の禁煙を促進するための、組成物。

【請求項 14】

錠剤は 1 日 1 回投与される、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

錠剤は 1 日 1 回以上投与される、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 16】

(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を HCl 水溶液の存在下で結晶化させ、(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩結晶を生産する段階を含む、2-クロロプロパンによる汚染を最小限に抑えながら (R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を製造する方法。

【請求項 17】

結晶化は、約 25 ~ 約 30 の温度で行われる、請求項 16 に記載の (R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を製造する方法。

【請求項 18】

(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩の結晶を約 35 以下の温度で乾燥する段階をさらに含む、請求項 16 または 17 に記載の (R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を製造する方法。

【請求項 19】

(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩中の 2-クロロプロパンの含量は約 5 ppm 未満である、請求項 16 から 18 のいずれか一項に記載の (R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を製造する方法。

【請求項 20】

約 5 ppm 未満の 2-クロロプロパンを含む、(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項 21】

(R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩は、請求項 16 から 19 のいずれか一項に記載の方法により製造される、請求項 20 に記載の (R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項 22】

組成物は剤形である、請求項 20 または 21 に記載の (R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項 23】

組成物は即時放出経口剤形である、請求項 22 に記載の (R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項 24】

組成物は、錠剤またはカプセルである、請求項 23 に記載の (R)-2-アミノ-3-フェニルプロピルカルバメート塩酸塩を含む組成物。

【請求項 25】

請求項 20 から 24 のいずれか一項に記載の組成物であって、それを必要とする対象のナルコレプシー (narcolepsy)、カタプレキシー (cataplexy)、日中の過剰な眠気 (excessive daytime sleepiness)、薬物中

毒 (drug addiction)、性機能障害 (sexual dysfunction)、疲労 (fatigue)、纖維筋肉痛 (fibromyalgia)、注意欠陥 / 多動性障害 (attention deficit / hyperactivity disorder)、下肢静止不能症候群 (restless legs syndrome)、うつ病 (depression)、双極性障害 (bipolar disorder) または肥満を治療するか、或いはそれを必要とする対象の禁煙を促進するための

、
組成物。

【請求項 26】

錠剤は 1 日 1 回投与 される、請求項 25 に記載の 組成物。

【請求項 27】

錠剤は 1 日 1 回以上投与 される、請求項 25 に記載の 組成物。