

【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 07 C 271/12 (2006.01)

A 61 K 31/27 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 15/10 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 25/34 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 3/02 (2006.01)

A 61 K 9/20 (2006.01)

A 61 K 9/48 (2006.01)

C 07 C 269/08 (2006.01)

【F I】

C 07 C 271/12 C S P

A 61 K 31/27

A 61 P 3/04

A 61 P 15/10

A 61 P 21/00

A 61 P 25/14

A 61 P 25/34

A 61 P 25/00

A 61 P 25/24

A 61 P 3/02

A 61 K 9/20

A 61 K 9/48

C 07 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 (f o r m) 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 - r a y d i f f r a c t i o n p a t t e r n) 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 $27.3 \pm 0.2^{\circ} 2\theta$ 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 filtration) 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)、繊維筋肉痛 (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)、繊維筋肉痛 (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。