

【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6月18日(2020.6.18)

【公表番号】特表2019-518736(P2019-518736A)

【公表日】令和1年7月4日(2019.7.4)

【年通号数】公開・登録公報2019-026

【出願番号】特願2018-559275(P2018-559275)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/4045	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
A 6 1 K	31/27	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00
A 6 1 K	31/519
A 6 1 K	31/4045
A 6 1 K	31/445
A 6 1 K	31/27
A 6 1 P	25/28

【手続補正書】

【提出日】令和2年4月30日(2020.4.30)

【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】

アセチルコリンエステラーゼ阻害剤の効果を向上又は増大させることによる、アパシーがアルツハイマー病と併存するアルツハイマー病の治療用医薬組成物であって、5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト又はその薬学的に許容される塩を含む医薬組成物。

【請求項2】

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストが、N-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミン、3-ベンゼンスルホニル-5,7-ジメチル-2-メチルスルファニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン及び3-フェニルスルホニル-8-ピペラジン-1-イル-キノリン並びにその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストが、N-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミンの薬学的に許容される塩である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストが、N-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミンの塩酸塩である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 5】**

前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤が、ドネペジル、リバスチグミン及びガランタミン又はその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 6】**

前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤がドネペジルの塩酸塩である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 7】**

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストがN-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミンの塩酸塩であり、前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤がドネペジルの塩酸塩である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 8】**

5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト又はその薬学的に許容される塩の用量範囲が30mg/日～60mg/日である、請求項1～7のいずれか一項に記載の医薬組成物。

**【請求項 9】**

5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト又はその薬学的に許容される塩、及びアセチルコリンエステラーゼ阻害剤又はその薬学的に許容される塩を含み、前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤がドネペジル又はその薬学的に許容される塩である、医薬組成物。

**【請求項 10】**

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストがN-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミンの塩酸塩であり、前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤がドネペジルの塩酸塩である、請求項9に記載の医薬組成物。

**【手続補正2】**

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0104

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0104】

関連のある精神医学的な試験（ADAS-cog及びNPIにより評価されるアパシー）は、上の説明において参照されており、全体が本明細書に組み込まれる。

本発明は以下の態様を含み得る。

[1]

アセチルコリンエステラーゼ阻害剤の効果を向上又は増大させることによる、アパシーがアルツハイマー病と併存するアルツハイマー病の治療に使用するための、5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト又はその薬学的に許容される塩。

[2]

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストが、N-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミン、3-ベンゼンスルホニル-5,7-ジメチル-2-メチルスルファニル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン及び3-フェニルスルホニル-8-ピペラジン-1-イル-キノリン並びにその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項1に記載の使用のための5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト又はその薬学的に許容される塩。

[3]

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストが、N-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベン

ジルアミンの薬学的に許容される塩である、請求項1に記載の使用のための5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト又はその薬学的に許容される塩。

[ 4 ]

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストが、N-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミンの塩酸塩である、請求項1に記載の使用のための5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト又はその薬学的に許容される塩。

[ 5 ]

前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤が、ドネペジル、リバスチグミン及びガランタミン又はその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項1に記載の使用のためのアセチルコリンエステラーゼ阻害剤。

[ 6 ]

前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤がドネペジルの塩酸塩である、請求項1に記載の使用のためのアセチルコリンエステラーゼ阻害剤。

[ 7 ]

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストがN-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミンの塩酸塩であり、前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤がドネペジルの塩酸塩である、請求項1に記載の使用のための5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト及びアセチルコリンエステラーゼ阻害剤。

[ 8 ]

用量範囲が30mg/日～60mg/日である、請求項3～7のいずれか一項に記載の使用のための5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト。

[ 9 ]

5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニスト又はその薬学的に許容される塩、及びアセチルコリンエステラーゼ阻害剤又はその薬学的に許容される塩を含む医薬組成物。

[ 10 ]

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストがN-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミン又はその薬学的に許容される塩であり、前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤がドネペジル又はその薬学的に許容される塩である、請求項9に記載の医薬組成物。

[ 11 ]

前記5-HT<sub>6</sub>受容体アンタゴニストがN-(2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-エチル)-3-(2,2,3,3-テトラフルオロプロポキシ)-ベンジルアミンの塩酸塩であり、前記アセチルコリンエステラーゼ阻害剤がドネペジルの塩酸塩である、請求項9に記載の医薬組成物。