

【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1年6月20日(2019.6.20)

【公表番号】特表2018-516906(P2018-516906A)

【公表日】平成30年6月28日(2018.6.28)

【年通号数】公開・登録公報2018-024

【出願番号】特願2017-560719(P2017-560719)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4015 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4015

A 6 1 P 25/28

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/02

【手続補正書】

【提出日】令和1年5月20日(2019.5.20)

【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】

a) 220mgのレベチラセタムと、

b) 280mg～350mgのヒドロキシプロピルメチルセルロースと、

c) 1.2mg～1.4mgのコロイド状二酸化ケイ素と、

d) 92.8mg～119.2mgの微結晶ケイ化セルロースと、

e) 6.0mg～6.7mgのステアリン酸マグネシウムと

を含む、持続放出性医薬組成物。

【請求項2】

a) 220mgのレベチラセタムと、

b) 280mgのヒドロキシプロピルメチルセルロースと、

c) 1.2mgのコロイド状二酸化ケイ素と、

d) 92.8mgの微結晶ケイ化セルロースと、

e) 6.0mgのステアリン酸マグネシウムと

を含む、持続放出性医薬組成物。

【請求項3】

a) 220mgのレベチラセタムと、

b) 347.5mgのヒドロキシプロピルメチルセルロースと、

c) 1.4mgのコロイド状二酸化ケイ素と、

d) 119.2mgの微結晶ケイ化セルロースと、

e) 6.7mgのステアリン酸マグネシウムと

を含む、持続放出性医薬組成物。

【請求項 4】

前記ヒドロキシプロピルメチルセルロースが、Methocel（商標）K15M CRまたはMethocel（商標）K100M Premium CRである、請求項1から3のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記ヒドロキシプロピルメチルセルロースが、Methocel（商標）K15M CRである、請求項1から3のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記微結晶ケイ化セルロースが、ProSolv（商標）HD90である、請求項1から5のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

- a) 190mgのレベチラセタムと、
- b) 300mgのヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
- c) 1.2mgのコロイド状二酸化ケイ素と、
- d) 102.8mgの微結晶ケイ化セルロースと、
- e) 6mgのステアリン酸マグネシウムと

を含む、持続放出性医薬組成物。

【請求項 8】

- a) 190mgのレベチラセタムと、
- b) 300mgのヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
- c) 1.2mgのコロイド状二酸化ケイ素と、
- d) 102.8mgの無水リン酸二カルシウムと、
- e) 6mgのステアリン酸マグネシウムと

を含む、持続放出性医薬組成物。

【請求項 9】

前記ヒドロキシプロピルメチルセルロースが、Methocel（商標）K15M CRまたはMethocel（商標）K100M Premium CRである、請求項7または8に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記ヒドロキシプロピルメチルセルロースが、Methocel（商標）K15M CRである、請求項7または8に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記微結晶ケイ化セルロースが、ProSolv（商標）HD90である、請求項7、9、および10のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

1日1回の投与用に製剤化されている、請求項1から11のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

1単位剤形の1日1回の投与用に製剤化されている、請求項1から11のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

錠剤の形態である、請求項1から13のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

錠剤1個の1日1回の投与用に製剤化されている、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

経口投与用に製剤化されている、請求項1から15のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

疎水性の速度制御ポリマーを含まない、請求項1から16のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

機能性コーティングを含まない、請求項1から16のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

認知機能障害を患っているまたはそのリスクを有する被験体における認知を向上することにおける使用のための、請求項1～18のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

前記認知機能障害が、中枢神経系(CNS)障害に関連する、請求項19に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 21】

前記認知機能障害が、加齢性認知機能障害、軽度認知機能障害、健忘性軽度認知機能障害、認知症、アルツハイマー病、統合失調症、筋萎縮性側索硬化症、外傷後ストレス障害、がん療法、双極性障害、精神遅滞、パーキンソン病、自閉症、強迫行動、または物質嗜癖のうちの1つまたは複数に関連している、請求項19または20に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 22】

アルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害または健忘性軽度認知機能障害の治療、あるいはアルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害または健忘性軽度認知機能障害の進行の減速を必要とするヒト被験体においてアルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害または健忘性軽度認知機能障害を治療する、あるいはアルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害または健忘性軽度認知機能障害の進行を減速することにおける使用のための、請求項1から18のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

レベチラセタムを含む持続放出医薬組成物であって、前記組成物が、投与後3時間以内に1.9μg/ml～4.4μg/mlの被験体におけるレベチラセタムの定常状態血漿濃度をもたらし、投与後24時間のうち少なくとも8時間持続する、組成物。

【請求項 24】

前記組成物が、投与後2時間以内にレベチラセタムの前記定常状態血漿濃度をもたらし、投与後24時間のうち少なくとも13時間持続する、請求項23に記載の組成物。

【請求項 25】

前記組成物が、投与後1時間以内にレベチラセタムの前記定常状態血漿濃度をもたらし、投与後24時間のうち少なくとも13時間持続する、請求項23に記載の組成物。

【請求項 26】

レベチラセタムを含む持続放出医薬組成物であって、前記組成物が、レベチラセタムの投与後1時間以内に、かつ投与後24時間のうち少なくとも8時間の間1.9μg/ml～4.4μg/mlの被験体におけるレベチラセタムの定常状態血漿濃度をもたらす、組成物。

【請求項 27】

認知機能障害を患っている、またはそのリスクを有する被験体における認知を向上することにおける使用のための、請求項23から26のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

前記認知機能障害が、中枢神経系(CNS)障害に関連する、請求項27に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 29】

前記認知機能障害が、加齢性認知機能障害、軽度認知機能障害、健忘性軽度認知機能障害、認知症、アルツハイマー病、統合失調症、筋萎縮性側索硬化症、外傷後ストレス障害、がん療法、双極性障害、精神遅滞、パーキンソン病、自閉症、強迫行動、または物質嗜癖のうちの1つまたは複数に関連している、請求項27または28に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 30】

アルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害または健忘性軽度認知機能障害の治療、あるいはアルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害または健忘性軽度認知機能障害の進行の減速を必要とするヒト被験体においてアルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害または健忘性軽度認知機能障害を治療する、あるいはアルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害または健忘性軽度認知機能障害の進行を減速することにおける使用のための、請求項23から29のいずれか一項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】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0023】

別の態様において、本発明は、本発明の持続放出性医薬組成物を投与することによって、それを必要とするヒト被験体におけるアルツハイマー病に起因する健忘性軽度認知機能障害の進行を減速する方法を提供する。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目1)

- a) 220mgのレベチラセタムと、
- b) 280mg～350mgのヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
- c) 1.2mg～1.4mgのコロイド状二酸化ケイ素と、
- d) 92.8mg～119.2mgの微結晶ケイ化セルロースと、
- e) 6.0mg～6.7mgのステアリン酸マグネシウムと

を含む、持続放出性医薬組成物。

(項目2)

- a) 220mgのレベチラセタムと、
- b) 280mgのヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
- c) 1.2mgのコロイド状二酸化ケイ素と、
- d) 92.8mgの微結晶ケイ化セルロースと、
- e) 6.0mgのステアリン酸マグネシウムと

を含む、持続放出性医薬組成物。

(項目3)

- a) 220mgのレベチラセタムと、
- b) 347.5mgのヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
- c) 1.4mgのコロイド状二酸化ケイ素と、
- d) 119.2mgの微結晶ケイ化セルロースと、
- e) 6.7mgのステアリン酸マグネシウムと

を含む、持続放出性医薬組成物。

(項目4)

前記ヒドロキシプロピルメチルセルロースが、Methocel(商標)K15MC
RまたはMethocel(商標)K100M Premium CRである、項目1から3のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目5)

前記ヒドロキシプロピルメチルセルロースが、Methocel(商標)K15MC
Rである、項目1から3のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目6)

前記微結晶ケイ化セルロースが、ProSolv(商標)HD90である、項目1から5のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目7)

a) 1 9 0 m g のレベチラセタムと、
b) 3 0 0 m g のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
c) 1 . 2 m g のコロイド状二酸化ケイ素と、
d) 1 0 2 . 8 m g の微結晶ケイ化セルロースと、
e) 6 m g のステアリン酸マグネシウムと
を含む、持続放出性医薬組成物。

(項目 8)

a) 1 9 0 m g のレベチラセタムと、
b) 3 0 0 m g のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
c) 1 . 2 m g のコロイド状二酸化ケイ素と、
d) 1 0 2 . 8 m g の無水リン酸二カルシウムと、
e) 6 m g のステアリン酸マグネシウムと
を含む、持続放出性医薬組成物。

(項目 9)

前記ヒドロキシプロピルメチルセルロースが、M e t h o c e l (商標) K 1 5 M C R またはM e t h o c e l (商標) K 1 0 0 M P r e m i u m C R である、項目 7 または 8 に記載の医薬組成物。

(項目 1 0)

前記ヒドロキシプロピルメチルセルロースが、M e t h o c e l (商標) K 1 5 M C R である、項目 7 または 8 に記載の医薬組成物。

(項目 1 1)

前記微結晶ケイ化セルロースが、P r o S o l v (商標) H D 9 0 である、項目 7 、 9 、および 1 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 1 2)

1 日 1 回の投与用に製剤化されている、項目 1 から 1 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 1 3)

1 単位剤形の 1 日 1 回の投与用に製剤化されている、項目 1 から 1 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 1 4)

錠剤の形態である、項目 1 から 1 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 1 5)

錠剤 1 個の 1 日 1 回の投与用に製剤化されている、項目 1 4 に記載の医薬組成物。

(項目 1 6)

経口投与用に製剤化されている、項目 1 から 1 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 1 7)

疎水性の速度制御ポリマーを含まない、項目 1 から 1 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 1 8)

機能性コーティングを含まない、項目 1 から 1 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目 1 9)

認知機能障害を患っているまたはそのリスクを有する被験体における認知を向上する方法であって、項目 1 ~ 1 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物を投与することを含む、方法。

(項目 2 0)

前記被験体が、中枢神経系 (C N S) 障害に関連する認知機能障害を患っているまたはそのリスクを有する、項目 1 9 に記載の方法。

(項目 2 1)

前記認知機能障害が、加齢性認知機能障害に関連している、項目 1 9 または 2 0 に記載の方法。

(項目22)

前記加齢性認知機能障害が、軽度認知機能障害である、項目21に記載の方法。

(項目23)

前記軽度認知機能障害が、健忘性軽度認知機能障害である、項目22に記載の方法。

(項目24)

前記認知機能障害が、認知症、アルツハイマー病、統合失調症、筋萎縮性側索硬化症、外傷後ストレス障害、がん療法、双極性障害、精神遅滞、パーキンソン病、自閉症、強迫行動、または物質嗜癖に関連している、項目19または20に記載の方法。

(項目25)

アルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害の治療を必要とするヒト被験体においてアルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害を治療する方法であって、項目1から18のいずれか一項に記載の医薬組成物を投与することを含む、方法。

(項目26)

アルツハイマー病に起因する健忘性軽度認知機能障害の治療を必要とするヒト被験体においてアルツハイマー病に起因する健忘性軽度認知機能障害を治療する方法であって、項目1から18のいずれか一項に記載の医薬組成物を投与することを含む、方法。

(項目27)

アルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害の進行の減速を必要とするヒト被験体においてアルツハイマー病に起因する軽度認知機能障害の進行を減速する方法であって、項目1から18のいずれか一項に記載の医薬組成物を投与することを含む、方法。

(項目28)

アルツハイマー病に起因する健忘性軽度認知機能障害の進行の減速を必要とするヒト被験体においてアルツハイマー病に起因する健忘性軽度認知機能障害の進行を減速する方法であって、項目1から18のいずれか一項に記載の医薬組成物を投与することを含む、方法。