

【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) 220 mg のレベチラセタムと、
- b) 280 mg ~ 350 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
- c) 1.2 mg ~ 1.4 mg のコロイド状二酸化ケイ素と、
- d) 92.8 mg ~ 119.2 mg の微結晶ケイ化セルロースと、
- e) 6.0 mg ~ 6.7 mg 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) 220 mg のレベチラセタムと、
- b) 280 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
- c) 1.2 mg のコロイド状二酸化ケイ素と、
- d) 92.8 mg の微結晶ケイ化セルロースと、
- e) 6.0 mg 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) 220 mg のレベチラセタムと、
- b) 347.5 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、
- c) 1.4 mg のコロイド状二酸化ケイ素と、
- d) 119.2 mg の微結晶ケイ化セルロースと、
- e) 6.7 mg 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の無水リン酸ニカルシウムと、
- 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 $1.9 \mu\text{g}/\text{ml} \sim 4.4 \mu\text{g}/\text{ml}$ 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、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す、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す、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 $1.9 \mu\text{g}/\text{ml} \sim 4.4 \mu\text{g}/\text{ml}$ 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) 220 mg のレベチラセタムと、

b) 280 mg ~ 350 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、

c) 1.2 mg ~ 1.4 mg のコロイド状二酸化ケイ素と、

d) 92.8 mg ~ 119.2 mg の微結晶ケイ化セルロースと、

e) 6.0 mg ~ 6.7 mg 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) 220 mg のレベチラセタムと、

b) 280 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、

c) 1.2 mg のコロイド状二酸化ケイ素と、

d) 92.8 mg の微結晶ケイ化セルロースと、

e) 6.0 mg 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) 220 mg のレベチラセタムと、

b) 347.5 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、

c) 1.4 mg のコロイド状二酸化ケイ素と、

d) 119.2 mg の微結晶ケイ化セルロースと、

e) 6.7 mg 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) K15M CR 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) K15M 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 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) 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。

(項目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の無水リン酸ニカルシウムと、
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。

(項目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、項目7または8に記載の医薬組成物。

(項目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、項目7または8に記載の医薬組成物。

(項目11)

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

(項目12)

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

(項目13)

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11のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目14)

錠剤の形態である、項目1から13のいずれか一項に記載の医薬組成物。

(項目15)

錠剤1個の1日1回の投与用に製剤化されている、項目14に記載の医薬組成物。

(項目16)

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

(項目17)

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

(項目18)

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

(項目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方法であって、項目1～18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20)

前記被験体が、中枢神経系(CNS)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19に記載の方法。

(項目21)

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19または20に記載の方法。

(項目 2 2)

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 2 1 に記載の方法。

(項目 2 3)

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 2 2 に記載の方法。

(項目 2 4)

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 1 9 または 2 0 に記載の方法。

(項目 2 5)

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 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 6)

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 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 7)

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 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 8)

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 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。