

【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】平成22年6月17日 (2010.6.17)

【公表番号】特表2009-536665(P2009-536665A)

【公表日】平成21年10月15日 (2009.10.15)

【年通号数】公開・登録公報2009-041

【出願番号】特願2009-510143(P2009-510143)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/65 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/44 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/65 C S P

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/18

A 6 1 K 31/44

【手続補正書】

【提出日】平成22年4月23日 (2010.4.23)

【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】

(2 S) - (4 E) - N - メチル - 5 - [3 - (5 - イソプロボキシピリジン) イル] - 4 - ペンテン - 2 - アミンの、リン酸塩、エジシル酸 (1 , 2 - エタンジスルホン酸) 塩、クエン酸塩、オロチン酸 (ウラシル - 6 - カルボン酸) 塩、R - マンデル酸塩、硫酸塩、1 , 5 - ナフタレンジスルホン酸塩、D - アスパラギン酸塩またはリシンー塩酸塩。

【請求項 2】

(2 S) - (4 E) - N - メチル - 5 - [3 - (5 - イソプロボキシピリジン) イル] - 4 - ペンテン - 2 - アミンと酸の化学量論比 (モル比) は 1 : 2 ~ 2 : 1 である、請求項 1 記載の塩。

【請求項 3】

(2 S) - (4 E) - N - メチル - 5 - [3 - (5 - イソプロボキシピリジン) イル] - 4 - ペンテン - 2 - アミンと酸の化学量論比 (モル比) は 1 : 1 である、請求項 1 記載の塩。

【請求項 4】

実質的に結晶性の形態である、請求項 1 記載のリン酸塩または 1 , 2 - エタンジスルホン酸塩。

【請求項 5】

特定ピークが 18.6、9.3、4.25、3.99 および 3.11 の d - 値に存在し、
そして / または本質的に

【表 1】

表 1 : リン酸塩の XRPD

距離(Å)	相対強度
18.6	vs
9.3	s
7.8	vw
7.1	w
6.7	w
6.5	vw
6.3	vw
6.2	m
6.1	vw
5.9	w
5.6	w
5.3	w
5.2	vw
5.1	vw
5.0	vw
4.83	w
4.77	w
4.69	m
4.59	w
4.53	vw
4.49	m
4.37	m
4.34	vw
4.25	m
4.21	w
4.14	vw
4.11	vw
4.07	vw
3.99	m
3.95	vw
3.92	w
3.76	vw
3.69	vw
3.65	vw
3.59	w
3.46	m
3.42	vw
3.36	m
3.25	w

【表 2】

表 1 のつづき

3.18	vw
3.11	m
3.01	vw
2.99	vw
2.83	vw
2.72	vw
2.67	vw
2.34	vw

(使用される定義 :

相対強度 (%) *	定義
80 ~ 100	vs (非常に強い)
30 ~ 80	s (強い)
4 ~ 30	m (中程度)
2 ~ 4	w (弱い)
<2	vw (非常に弱い)

* 相対強度は可変スリットで測定された回折図形から得られる)

で定義された X - 線粉末回折パターンを有する、請求項 1 記載のリン酸塩。

【請求項 6】

特定ピークが 5.6、4.33、4.19 および 3.76 の d - 値に存在し、そして / または本質的に

【表 3】

表 2 : エジシル酸塩

距離(Å)	相対強度
18.0	w
9.4	m
9.2	m
7.7	w
7.3	m
6.0	w
5.8	w
5.6	m
5.5	w
5.2	w
4.9	w
4.8	vw
4.7	m
4.6	m
4.6	m
4.44	s
4.33	s
4.27	w
4.19	s
4.11	w
3.95	vw
3.85	vw
3.80	w
3.76	m
3.66	w
3.63	m
3.61	m
3.51	w
3.37	w
3.35	w
3.26	w
3.24	w
3.21	w
3.18	w
3.12	vw
3.08	w
2.87	vw
2.77	vw
2.67	vw

(使用される定義 :

相対強度 (%) *

定義

-

vs (非常に強い)

60 ~ 100	s (強い)
20 ~ 60	m (中程度)
8 ~ 20	w (弱い)
<8	vw (非常に弱い)

* 相対強度は可変スリットで測定された回折図形から得られる)

で定義された X - 線粉末回折パターンを有する、請求項 1 記載のエジシル酸塩。

【請求項 7】

中枢神経系疾患を治療するための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 6 の何れかの項記載の塩の使用。

【請求項 8】

疾患は、加齢による記憶障害、軽度の認識機能障害、初老期認知症（早期アルツハイマー病）、老年性認知症（アルツハイマー型認知症）、レビー小体型認知症、血管性認知症、アルツハイマー病、卒中、エイズによる認知症、注意欠陥障害、注意欠陥多動性障害、失読症、統合失調症、統合失調症様障害および統合失調性感情障害からなる群より選択される、請求項 7 記載の使用。

【請求項 9】

活性成分として治療的に有効な量の請求項 1 ~ 6 の何れかの項記載の塩を、1 種またはそれ以上の薬学的に許容しうる希釈剤、賦形剤および / または不活性担体と一緒に含有する、医薬組成物。

【請求項 10】

活性成分として請求項 1 ~ 6 の何れかの項記載の塩を含有する、中枢神経系疾患を治療するための薬剤。