

【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 19 年 1 月 25 日 (2007.1.25)

【公表番号】特表 2003-524613 (P2003-524613A)

【公表日】平成 15 年 8 月 19 日 (2003.8.19)

【出願番号】特願 2000-585198 (P2000-585198)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/137	(2006.01)
A 6 1 K	9/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	13/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/30	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 C	209/48	(2006.01)
C 0 7 C	209/68	(2006.01)
C 0 7 C	209/78	(2006.01)
C 0 7 C	209/88	(2006.01)
C 0 7 C	211/27	(2006.01)
C 0 7 B	57/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/137
A 6 1 K	9/00
A 6 1 K	9/20
A 6 1 K	9/48
A 6 1 K	47/12
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	47/38
A 6 1 P	3/04
A 6 1 P	9/10
A 6 1 P	13/02
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	25/04

A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/30
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 C 209/48
C 0 7 C 209/68
C 0 7 C 209/78
C 0 7 C 209/88
C 0 7 C 211/27
C 0 7 B 57/00 3 6 0
C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成18年11月30日(2006.11.30)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩と、製薬上許容し得る担体または賦形剤とを含んでなる医薬組成物。

【請求項2】 (-)-ベンラファキシン誘導体が、(-)-0-デスメチルベンラファキシン、(-)-N-デスメチルベンラファキシン、(-)-N,0-ジデスメチルベンラファキシンおよび(-)-N,N-ジデスメチルベンラファキシンからなる群より選択されるものである、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項3】 (-)-ベンラファキシン誘導体が、(-)-0-デスメチルベンラファキシンまたは(-)-N,0-ジデスメチルベンラファキシンである、請求項2記載の医薬組成物。

【請求項4】 静脈内注入、経皮送達、または経口送達に適合した、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項5】 (-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の量が、ラセミ体ベンラファキシン誘導体の総重量の約90重量%を超える量を占める、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項6】 (-)-ベンラファキシン誘導体が、その塩酸塩を含んでなる、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項7】 前記製薬上許容し得る賦形剤が、ラクトース、クロスカルメロースナトリウム、微晶質セルロース、前糊化デンプン、およびステアリン酸マグネシウムを含んでなる、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項8】 実質的に全ての単糖類または二糖類を含まない、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項9】 ラクトースを含まない、請求項8記載の医薬組成物。

【請求項10】 (-)-ベンラファキシン誘導体が(-)-0-デスメチルベンラファキシンであり、賦形剤がラクトースを含んでなるものである、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項11】 賦形剤が、微晶質セルロース、前糊化デンプン、ステアリン酸マグネシウム、およびクロスカルメロースナトリウムをさらに含んでなる、請求項10記載の医薬

組成物。

【請求項 1 2】 (+)立体異性体を実質的に含まない治療上有効な量の(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩と、製薬上許容し得る担体または賦形剤とを含んでなる医薬剤形。

【請求項 1 3】 錠剤またはカプセル剤である、請求項 1 2 記載の剤形。

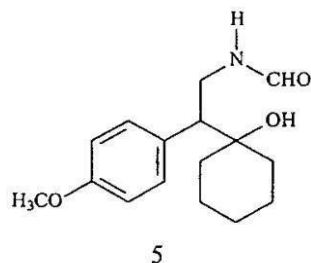
【請求項 1 4】 静脈内注入、経皮送達、または経口送達に適合した、請求項 1 2 記載の剤形。

【請求項 1 5】 治療上有効な量が約10mg～約1000mgである、請求項 1 4 記載の剤形。

【請求項 1 6】 治療上有効な量が約50mg～約500mgである、請求項 1 5 記載の剤形。

【請求項 1 7】 治療上有効な量が約75mg～約350mgである、請求項 1 6 記載の剤形。

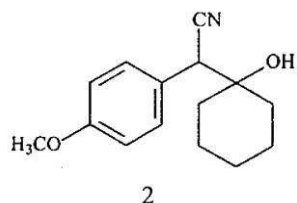
【請求項 1 8】 (-)-N-デスメチルベンラファキシンの製造方法であって、式 5：



の化合物と還元剤とを、(±)-N-デスメチルベンラファキシンを形成するのに十分な時間および温度にて接触させ、(-)-N-デスメチルベンラファキシンを単離することを含んでなる前記方法。

【請求項 1 9】 還元剤が $\text{BH}_3 \cdot \text{Me}_2\text{S}$ である、請求項 1 8 記載の方法。

【請求項 2 0】 (-)-N,N-ジデスメチルベンラファキシンの製造方法であって、式 2：



の化合物と還元剤とを、(±)-N,N-ジデスメチルベンラファキシンを形成するのに十分な時間および温度にて接触させ、(-)-N,N-ジデスメチルベンラファキシンを単離することを含んでなる前記方法。

【請求項 2 1】 還元剤が $\text{CoCl}_2 / \text{NaBH}_4$ である、請求項 2 0 記載の方法。

【請求項 2 2】 (-)-0-デスメチルベンラファキシンの製造方法であって、(±)-ベンラファキシンとリチウムジフェニルホスフィドとを、(±)-0-デスメチルベンラファキシンを形成するのに十分な時間および温度にて接触させ、(-)-0-デスメチルベンラファキシンを単離することを含んでなる前記方法。

【請求項 2 3】 実質的に純粋な(-)-0-デスメチルベンラファキシン、並びにその製薬上許容し得る塩、溶媒和物および包接体。

【請求項 2 4】 実質的に純粋な(-)-N,0-ジデスメチルベンラファキシン、並びにその製薬上許容し得る塩、溶媒和物および包接体。

【請求項 2 5】 (-)-N-デスメチルベンラファキシン、並びにその製薬上許容し得る塩、溶媒和物および包接体。

【請求項 2 6】 (-)-N,N-ジデスメチルベンラファキシン、並びにその製薬上許容し得る塩、溶媒和物および包接体。

【請求項 27】哺乳動物の情動障害を治療する医薬の製造のための (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 28】 (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩が、情動障害を緩和するのには十分であるが、ラセミ体ベンラファキシンの投与に付随する有害作用を引き起こすには至らない量である、請求項 27 記載の使用。

【請求項 29】 情動障害が、鬱病、注意欠陥障害、および過活動を伴う注意欠陥障害からなる群より選択されるものである、請求項 27 記載の使用。

【請求項 30】哺乳動物の肥満または体重増加を治療する医薬の製造のための (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 31】 (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩が、肥満または体重増加を緩和するのには十分であるが、ラセミ体ベンラファキシンの投与に付随する有害作用を引き起こすには至らない量である、請求項 30 記載の使用。

【請求項 32】 哺乳動物のニューロンへのモノアミンの再取込みを抑制することで改善される障害を治療する医薬の製造のための (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 33】 (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩が、前記障害を緩和するのには十分であるが、ラセミ体ベンラファキシンの投与に付随する有害作用を引き起こすには至らない量である、請求項 32 記載の使用。

【請求項 34】 前記モノアミンがドーパミンである、請求項 32 記載の使用。

【請求項 35】 前記障害がパーキンソン病またはてんかんである、請求項 32 記載の使用。

【請求項 36】 哺乳動物の脳の機能障害を治療する医薬の製造のための (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 37】 (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩が、脳の機能障害を緩和するのには十分であるが、ラセミ体ベンラファキシンの投与に付随する有害作用を引き起こすには至らない量である、請求項 36 記載の使用。

【請求項 38】 前記脳の機能障害が、脳血管疾患によって引き起こされるものである、請求項 36 記載の使用。

【請求項 39】 前記脳血管疾患が、脳梗塞、脳内出血、脳動脈硬化症、脳静脈血栓症、および頭部損傷からなる群より選択されるものである、請求項 38 記載の使用。

【請求項 40】 前記脳の機能障害が、老年性痴呆症、アルツハイマー型痴呆症、記憶喪失、および健忘症 / 健忘症候群からなる群より選択されるものである、請求項 36 記載の使用。

【請求項 41】 哺乳動物の疼痛を治療する医薬の製造のための (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 42】 (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩が、疼痛を緩和するのには十分であるが、ラセミ体ベンラファキシンの投与に付随する有害作用を引き起こすには至らない量である、請求項 41 記載の使用。

【請求項 43】 疼痛が慢性の疼痛である、請求項 41 記載の使用。

【請求項 44】 哺乳動物の強迫性障害を治療する製造のための (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 45】 哺乳動物の物質乱用を治療する医薬の製造のための (+)立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 46】 哺乳動物の月経前症候群を治療または予防する医薬の製造のための (+)立

体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 47】 哺乳動物の不安を治療する医薬の製造のための(+)-立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 48】 哺乳動物の摂食障害を治療する医薬の製造のための(+)-立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 49】 哺乳動物の片頭痛を治療または予防する医薬の製造のための(+)-立体異性体を実質的に含まない (-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 50】 哺乳動物の失禁を治療または予防する医薬の製造のための(+)-立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩の使用。

【請求項 51】 前記失禁が、便失禁、溢流失禁、受動失禁、反射性失禁、腹圧性尿失禁、切迫失禁、運動性尿失禁、および尿失禁からなる群より選択されるものである、請求項 50 記載の使用。

【請求項 52】 (-)-ベンラファキシン誘導体が、(-)-0-デスメチルベンラファキシン、(-)-N-デスメチルベンラファキシン、(-)-N,0-ジデスメチルベンラファキシン、および(-)-N,N-ジデスメチルベンラファキシンからなる群より選択されるものである、請求項 27 記載の使用。

【請求項 53】 (-)-ベンラファキシン誘導体が、(-)-0-デスメチルベンラファキシンまたは(-)-N,0-ジデスメチルベンラファキシンである、請求項 52 記載の方法。

【請求項 54】 (-)-ベンラファキシン誘導体を、静脈内注入もしくは経皮送達によって投与するか、または錠剤もしくはカプセル剤として経口投与する、請求項 27 記載の使用。

【請求項 55】 (+)-立体異性体を実質的に含まない (-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩が 1 日当たり約 10mg ~ 約 1000mg の投与量である、請求項 27 記載の使用。

【請求項 56】 投与量が 1 日当たり約 50mg ~ 約 500mg である、請求項 55 記載の使用。

【請求項 57】 投与量が 1 日当たり約 75mg ~ 約 350mg である、請求項 56 記載の使用。

【請求項 58】 (-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩が、ラセミ体ベンラファキシン誘導体の総重量の約 90 重量 % を超える量である、請求項 27 記載の使用。

【請求項 59】 (+)-立体異性体を実質的に含まない(-)-ベンラファキシン誘導体またはその製薬上許容し得る塩を、製薬上許容し得る担体と共に投与する、請求項 27 記載の使用。

【請求項 60】 (-)-ベンラファキシン誘導体を塩酸塩として投与する、請求項 27 記載の使用。