

【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30年6月7日(2018.6.7)

【公表番号】特表2017-511386(P2017-511386A)

【公表日】平成29年4月20日(2017.4.20)

【年通号数】公開・登録公報2017-016

【出願番号】特願2017-506256(P2017-506256)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 25/26 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 25/26

A 6 1 P 25/16

【手続補正書】

【提出日】平成30年4月16日(2018.4.16)

【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】

対象において過眠症を治療するための、ペンチレンテトラゾール(PTZ)を含む薬学的組成物。

【請求項2】

上記PTZは、少なくとも毎日一度、少なくとも五日間連続で投与されるものである、請求項1の薬学的組成物。

【請求項3】

上記PTZは、一日一度、一日二度、一日三度、または一日四度投与されるものである、請求項1の薬学的組成物。

【請求項4】

上記PTZは、約1mgから1,500mgの投与量で投与されるものである、請求項1の薬学的組成物。

【請求項5】

上記PTZは、約5mgから1,000mgの投与量で投与されるものである、請求項1の薬学的組成物。

【請求項6】

上記PTZは、約10mgから800mgの投与量で投与されるものである、請求項1の薬学的組成物。

【請求項7】

上記PTZは、約25mgから600mgの投与量で投与されるものである、請求項1の薬学的組成物。

【請求項8】

上記PTZは、約25から25,000ng/mlの平均Cmaxを達成するために十分な投与量で投与されるものである、請求項1の薬学的組成物。

【請求項9】

上記 P T Z は、約 50 から 20,000 ng / mL の平均 Cmax を達成するために十分な投与量で投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 10】

上記 P T Z は、約 100 から 15,000 ng / mL の平均 Cmax を達成するために十分な投与量で投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 11】

上記 P T Z は、約 500 から 10,000 ng / mL の平均 Cmax を達成するために十分な投与量で投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 12】

上記 P T Z は、約 1,000 から 8,000 ng / mL の平均 Cmax を達成するために十分な投与量で投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 13】

上記 P T Z は、約 3,000 から 6,000 ng / mL の平均 Cmax を達成するために十分な投与量で投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 14】

上記 P T Z は、上記対象の夜間の睡眠に先立って、または、上記対象の夜間の睡眠の間に投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 15】

上記 P T Z は、上記対象の朝の目覚めの期間に先立って、または、上記対象の朝の目覚めの期間に投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 16】

上記 Cmax は、脳において達成される、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 17】

上記 P T Z は、経口製剤で投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 18】

上記 P T Z は、遅延放出製剤で投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 19】

上記遅延放出製剤は、投与の時間から、30 分後から 12 時間後まで、脳における P T Z の最高濃度を延期する、請求項 18 の薬学的組成物。

【請求項 20】

上記遅延放出製剤は、上記対象の夜間の睡眠の間に、または、上記対象の朝の目覚めの期間に、P T Z を放出する、請求項 18 の薬学的組成物。

【請求項 21】

上記 P T Z は、持続放出製剤で投与されるものである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 22】

上記持続放出製剤は、投与後、30 分間から 12 時間、上記 P T Z の治療的有効投与量を維持する、請求項 21 の薬学的組成物。

【請求項 23】

上記 P T Z は、約 500 ng * hr / mL から 150,000 ng * hr / mL の AUC を達成するために調剤される、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 24】

上記 P T Z は、約 1,000 ng * hr / mL から 100,000 ng * hr / mL の AUC を達成するために調剤される、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 25】

上記 P T Z は、約 5,000 ng * hr / mL から 50,000 ng * hr / mL の AUC を達成するために調剤される、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 26】

上記 P T Z は、約 10,000 ng * hr / mL から 20,000 ng * hr / mL の AUC を達成するために調剤される、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 27】

上記 P T Z は、約 1 , 0 0 0 n g * h r / m L から 5 0 , 0 0 0 n g * h r / m L の A U C を達成するために調剤される、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 2 8】

上記対象はヒトである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 2 9】

上記過眠症を有する上記対象の脳脊髄液 (C S F) は、上記過眠症を有さない対象の上記 C S F と相対的に、高水準の内在性ポジティブ G A B A_A 受容体アロステリック調節物質を含む、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 0】

上記過眠症候群 (hypersomnia syndrome) は、上記対象における内在性ポジティブアロステリック G A B A_A 受容体調節物質によって仲介される、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 1】

上記過眠症は、原発性過眠症である、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 2】

上記過眠症は、特発性過眠症、反復性過眠症、交代勤務睡眠障害、下肢静止不能症候群、夜間ジストニア、夜間運動障害、クライン - レヴィン症候群、パーキンソン病、過剰な眠気、閉塞性睡眠時無呼吸、R E M 行動障害、エンドゼピソニン関連性反復性昏迷 (endozepine related recurrent stupor) 、前頭葉性夜間ジストニア (frontal nocturnal dystonia) 、夜間運動障害、ナルコレプシーおよびアンフェタミン抵抗性過眠症 (amphetamine resistant hypersomnia) からなる群から選択される型である、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 3】

上記過眠症は、特発性過眠症である、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 4】

上記過眠症は、カタプレキシーを伴わないナルコレプシーである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 5】

上記過眠症は、カタプレキシーを伴うナルコレプシーである、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 6】

過眠症を有する上記対象は、スタンフォード眠気尺度 (S S S) 、エプワース眠気尺度 (E S S) 、睡眠潜時反復 (M S L) 検査、覚醒維持検査 (M W T) 、客観的精神運動警戒タスク (objective psychomotor vigilance tasks) (P V T) 、睡眠機能転帰質問票 (Functional Outcomes of Sleep Questionnaire) (F O S Q) 、多角的疲労評価尺度 (Multidimensional Fatigue Inventory) (M F I) 、重症度の臨床的全般印象度 (Clinical Global Impression of Severity) (C G I - S) 、改善度の臨床的全般印象度 (Clinical Global Impression of Change) (C G I - C) 、ベックうつ病質問票 (Beck Depression Inventory) (B D I - I I) 、自己報告性の頭が朦朧とすることのスコア (self-reportedogginess scores) 、自己報告性憂鬱スコア (self-reported mood scores) 、または自己報告性眠気スコア (self-reported sleepiness scores) 、に基づいて評価される、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 7】

過眠症を有する上記対象は、上記 E S S について少なくとも約 3 点、 M W T における入眠潜時 (S O L) に対して少なくとも約 2 分間、上記 F O S Q について少なくとも約 8 点、一つ以上の M F I 尺度について少なくとも約 4 点、 C G I - S もしくは C G I - C について少なくとも 1 点、上記 B D I - I I について少なくとも約 4 点、または、自己報告性の頭が朦朧とすることのスコアについて、少なくとも約 1 . 0 点、の差で改善する、請求項 3 5 の薬学的組成物。

【請求項 3 8】

上記過眠症は、続発性過眠症である、請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3 9】

P T Z は、毎日二度、100mg の投与量で、少なくとも一週間の期間、投与される、
請求項 1 の薬学的組成物。