

【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7年3月25日(2025.3.25)

【国際公開番号】WO2022/197901

【公表番号】特表2024-510436(P2024-510436A)

【公表日】令和6年3月7日(2024.3.7)

【年通号数】公開公報(特許)2024-043

【出願番号】特願2023-554337(P2023-554337)

【国際特許分類】

A 6 1 K 3 1 / 5 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 2 5 / 2 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【F I】

A 6 1 K 3 1 / 5 8

A 6 1 P 2 5 / 2 4

10

【手続補正書】

【提出日】令和7年3月14日(2025.3.14)

【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】

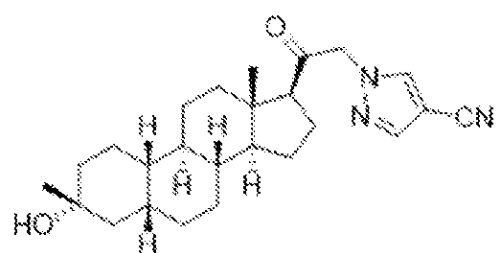
【請求項1】

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置するための方法における使用のための組成物であって、前記組成物は、化合物(1)：

【化39】

20

30



化合物(1)

または化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を含み、

前記方法は、

(i) 治療有効量の化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて治療有効量の化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を投与することを含む、実施することを含む、

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースは、前記初期処置コースの開始から12ヶ月の期間にわたって実施されることを特徴とする、組成物。

【請求項2】

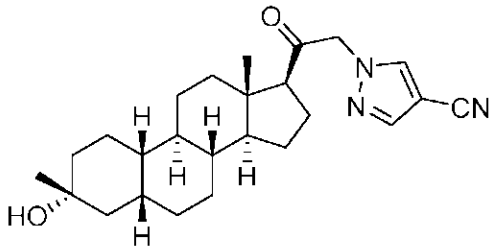
大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(

40

50

MDD)を処置するための方法における使用のための組成物であって、前記組成物は、化合物(1)：

【化40】



化合物(1)

10

または化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を含み、前記方法は、

(i) 治療有効量の化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて治療有効量の化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を投与することを含む、実施することを含み、

20

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースは、前記初期処置コースの開始から12ヶ月の期間にわたって実施されることを特徴とし、

前記被験体は、処置ナীবである、組成物。

【請求項3】

(A) 前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、少なくとも約4週間、少なくとも約6週間、または少なくとも約8週間の間隔があげられることを特徴とする、あるいは

(B) 前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、約4週間、約6週間、または約8週間の間隔があげられることを特徴とする、

請求項1または請求項2に記載の組成物。

30

【請求項4】

(A) 前記初期処置コースの期間が、約2週間または約14日間である、および/あるいは

(B) 各々のその後の処置コースの期間が、約2週間または約14日間である、

請求項1～3のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項5】

(A) 化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩が、前記初期処置コースにおいて、約14日間、1日に1回投与されることを特徴とする、および/あるいは

(B) 化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩が、各々のその後の処置コースにおいて、約14日間、1日に1回投与されることを特徴とする、

請求項1～4のいずれか1項に記載の組成物。

40

【請求項6】

化合物(1)が、約20mg～約55mgの用量で投与されることを特徴とする、または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩が、約20mg～約55mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与されることを特徴とする、請求項1～5のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項7】

化合物(1)が、

(A) 2 が9.7～10.1度の間(両端の数値を含む)、2 が11.6～12.0

50

度の間（両端の数値を含む）、2 が 13.2 ~ 13.6 度の間（両端の数値を含む）、2 が 14.2 ~ 14.6 度の間（両端の数値を含む）、2 が 14.6 ~ 15.0 度の間（両端の数値を含む）、2 が 16.8 ~ 17.2 度の間（両端の数値を含む）、2 が 20.5 ~ 20.9 度の間（両端の数値を含む）、2 が 21.3 ~ 21.7 度の間（両端の数値を含む）、2 が 21.4 ~ 21.8 度の間（両端の数値を含む）、および 2 が 22.4 ~ 22.8 度の間（両端の数値を含む）のピークを含む XRPD パターン；  
 (B) 2 が 9.3 ~ 9.7 度の間（両端の数値を含む）、2 が 10.6 ~ 11.0 度の間（両端の数値を含む）、2 が 13.0 ~ 13.4 度の間（両端の数値を含む）、2 が 14.7 ~ 15.1 度の間（両端の数値を含む）、2 が 15.8 ~ 16.2 度の間（両端の数値を含む）、2 が 18.1 ~ 18.5 度の間（両端の数値を含む）、2 が 18.7 ~ 19.1 度の間（両端の数値を含む）、2 が 20.9 ~ 21.3 度の間（両端の数値を含む）、2 が 21.4 ~ 21.8 度の間（両端の数値を含む）、および 2 が 23.3 ~ 23.7 度の間（両端の数値を含む）のピークを含む XRPD パターン；  
 (C) 2 が 9.7 ~ 10.1 度の間（両端の数値を含む）、2 が 14.6 ~ 15.0 度の間（両端の数値を含む）、2 が 16.8 ~ 17.2 度の間（両端の数値を含む）、2 が 20.5 ~ 20.9 度の間（両端の数値を含む）、および 2 が 21.3 ~ 21.7 度の間（両端の数値を含む）のピークを含む XRPD パターン；または  
 (D) 2 が 9.3 ~ 9.7 度の間（両端の数値を含む）、2 が 10.6 ~ 11.0 度の間（両端の数値を含む）、2 が 13.0 ~ 13.4 度の間（両端の数値を含む）、2 が 18.7 ~ 19.1 度の間（両端の数値を含む）、および 2 が 21.4 ~ 21.8 度の間（両端の数値を含む）のピークを含む XRPD パターン

10

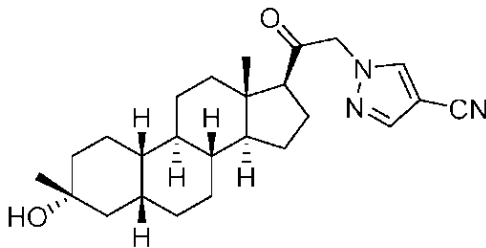
20

を有する結晶形態にある、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 8】

大うつ病性障害（MDD）を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害（MDD）を処置するための方法における使用のための組成物であって、前記組成物は、化合物（1）；

【化 4 3】



化合物(1)

30

または化合物（1）の薬学的に許容され得る塩を含み、  
 前記方法は、

(i) 約 30 mg ~ 約 50 mg の化合物（1）または約 30 mg ~ 約 50 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量の化合物（1）の前記薬学的に許容され得る塩の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

40

(ii) 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約 30 mg ~ 約 50 mg の化合物（1）または約 30 mg ~ 約 50 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量の化合物（1）の前記薬学的に許容され得る塩を前記被験体に投与することを含む、実施することを含み、

ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースは、前記初期処置コースの開始から 12 ヶ月の期間にわたって実施されることを特徴とする、組成物。

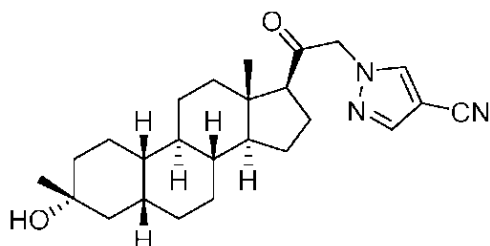
【請求項 9】

大うつ病性障害（MDD）を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害（

50

MDD)を処置するための方法における使用のための組成物であって、前記組成物は、化合物(1)：

【化45】



化合物(1)

10

または化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を含み、前記方法は、

(i) 約30mg～約50mgの化合物(1)または約30mg～約50mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量の化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩の約14日間、1日に1回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約30mg～約50mgの化合物(1)または約30mg～約50mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量の化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を前記被験体に約14日間、1日に1回投与することを含む、実施すること

20

を含み、

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースは、前記初期処置コースの開始から12ヶ月の期間にわたって実施されることを特徴とし、

必要に応じて、前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間になくとも約6週間の間隔があげられることを特徴とする、または

必要に応じて、前記被験体は、さらなる抗うつ病薬を少なくとも60日間安定的に服用している、

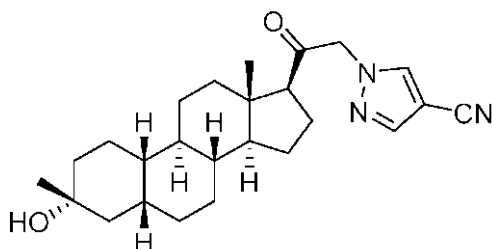
組成物。

30

【請求項10】

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置するための方法における使用のための組成物であって、前記組成物は、化合物(1)：

【化51】



化合物(1)

40

または化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を含み、前記方法は、

(i) 約45mg～約55mgの化合物(1)または約45mg～約55mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量の化合物(1)の薬学的に許容され得る塩の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであっ

50

て、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約 45 mg ~ 約 55 mg の化合物 (1) または約 45 mg ~ 約 55 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量の化合物 (1) の薬学的に許容され得る塩を前記被験体に投与することを含む、実施すること

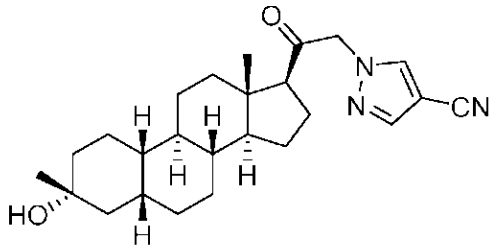
を含み、  
ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースは、前記初期処置コースの開始から 12 ヶ月の期間にわたって実施されることを特徴とする、組成物。

【請求項 11】

大うつ病性障害 (MDD) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 (MDD) を処置するための方法における使用のための組成物であって、前記組成物は、化合物 (1) :

10

【化 53】



化合物 (1)

20

または化合物 (1) の薬学的に許容され得る塩を含み、  
前記方法は、

(i) 約 45 mg ~ 約 55 mg の化合物 (1) または約 45 mg ~ 約 55 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量の化合物 (1) の薬学的に許容され得る塩の約 14 日間、1日に 1 回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること ; および

(ii) 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約 45 mg ~ 約 55 mg の化合物 (1) または約 45 mg ~ 約 55 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量の化合物 (1) の薬学的に許容され得る塩を前記被験体に約 14 日間、1日に 1 回投与することを

30

を含み、

ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースは、前記初期処置コースの開始から 12 ヶ月の期間にわたって実施されることを特徴とし、

必要に応じて、前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間になくとも約 6 週間の間隔があげられることを特徴とする、  
組成物。

【請求項 12】

0 または 1 回のその後の処置コースが実施されることを特徴とする、あるいは 1 回のその後の処置コースが実施されることを特徴とする、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

40

【請求項 13】

(A) 化合物 (1) が、約 50 mg の用量で投与される、または化合物 (1) の前記薬学的に許容され得る塩が、約 50 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与されることを特徴とする、あるいは

(B) 化合物 (1) が、約 40 mg の用量で投与される、または化合物 (1) の前記薬学的に許容され得る塩が、約 40 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与されることを特徴とする、

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 14】

50

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩が、経口で、非経口で、皮内で、髄腔内で、筋肉内で、皮下で、腔で、頬側として、舌下で、直腸で、局所で、吸入として、鼻腔内で、または経皮で投与されることを特徴とする、請求項1～13のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項15】

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩が、経口投与されることを特徴とする、請求項14に記載の組成物。

【請求項16】

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩が、食物とともに投与されることを特徴とする、請求項1～15のいずれか1項に記載の組成物。

10

【請求項17】

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩が、夜間に1日1回投与されることを特徴とする、請求項1～16のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項18】

前記被験体が処置ナীবである、請求項1または3～17のいずれか1項に記載の組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0042

【補正方法】変更

20

【補正の内容】

【0042】

一部の実施形態において、被験体は処置ナীবである。

本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

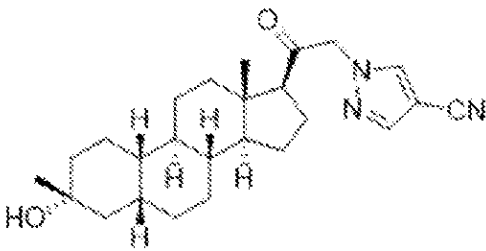
(項目1)

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置する方法であって、

(i)治療有効量の化合物(1)；

【化39】

30



化合物(1)

の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii)0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて治療有効量の化合物(1)を投与することを含む、実施すること

40

を含み、ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

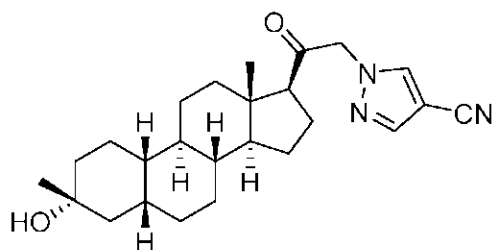
(項目2)

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置する方法であって、

(i)治療有効量の化合物(1)；

50

【化 4 0】



化合物 (1)

10

の薬学的に許容され得る塩の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

( i i ) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて治療有効量の化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を投与することを含む、実施すること

を含み、

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを、前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

(項目3)

0または1回のその後の処置コースを実施する、項目1または項目2に記載の方法。

20

(項目4)

1回のその後の処置コースを実施する、項目1または項目2に記載の方法。

(項目5)

前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、少なくとも約4週間、少なくとも約6週間、または少なくとも約8週間の間隔をあげる、項目1~4のいずれか1項に記載の方法。

(項目6)

前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、約4週間、約6週間、または約8週間の間隔をあげる、項目1~4のいずれか1項に記載の方法。

(項目7)

うつ病症状の前記再発を、ハミルトンうつ病評価尺度(HAM-D)、モントゴメリー-アスベルグうつ病評価尺度(MADRS)、患者健康状態質問票(PHQ-9)、またはこれらの組み合わせを使用した前記被験体の評価によって示す、項目1~6のいずれか1項に記載の方法。

30

(項目8)

前記被験体におけるうつ病症状の前記再発を、10もしくはそれを超えるPHQ-9スコアまたは20もしくはそれを超えるHAM-Dスコアによって示す、項目1~7のいずれか1項に記載の方法。

(項目9)

前記初期処置コースの期間が、約2週間または約14日間である、項目1~8のいずれか1項に記載の方法。

40

(項目10)

各々のその後の処置コースの期間が、約2週間または約14日間である、項目1~9のいずれか1項に記載の方法。

(項目11)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、前記初期処置コースにおいて、約14日間、1日に1回投与する、項目1~10のいずれか1項に記載の方法。

(項目12)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、各々のその後の処置

50

コースにおいて、約 14 日間、1 日に 1 回投与する、項目 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 13)

化合物(1)を、約 20 mg ~ 約 55 mg の用量で投与する、項目 1 に記載の方法。

(項目 14)

化合物(1)を、約 50 mg の用量で投与する、項目 1 に記載の方法。

(項目 15)

化合物(1)を、約 40 mg の用量で投与する、項目 1 に記載の方法。

(項目 16)

化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、約 20 mg ~ 約 55 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与する、項目 2 に記載の方法。

(項目 17)

化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、約 50 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与する、項目 2 に記載の方法。

(項目 18)

化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、約 40 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与する、項目 2 に記載の方法。

(項目 19)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、経口、非経口、皮内、髄腔内、筋肉内、皮下、膺、頬側として、舌下、直腸、局所、吸入として、鼻腔内、または経皮に投与する、項目 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 20)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、経口投与する、項目 19 に記載の方法。

(項目 21)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を食物とともに投与する、項目 1 ~ 20 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 22)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、夜間に 1 日 1 回投与する、項目 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 23)

化合物(1)が、 $2\theta$  が 9.7 ~ 10.1 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 11.6 ~ 12.0 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 13.2 ~ 13.6 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 14.2 ~ 14.6 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 14.6 ~ 15.0 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 16.8 ~ 17.2 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 20.5 ~ 20.9 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 21.3 ~ 21.7 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 21.4 ~ 21.8 度の間(両端の数値を含む)、および  $2\theta$  が 22.4 ~ 22.8 度の間(両端の数値を含む)のピークを含む XRPD パターンを有する結晶形態にある、項目 1 に記載の方法。

(項目 24)

化合物(1)が、 $2\theta$  が 9.3 ~ 9.7 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 10.6 ~ 11.0 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 13.0 ~ 13.4 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 14.7 ~ 15.1 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 15.8 ~ 16.2 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 18.1 ~ 18.5 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 18.7 ~ 19.1 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 20.9 ~ 21.3 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 21.4 ~ 21.8 度の間(両端の数値を含む)、および  $2\theta$  が 23.3 ~ 23.7 度の間(両端の数値を含む)のピークを含む XRPD パターンを有する結晶形態にある、項目 1 に記載の方法。

(項目 25)

化合物(1)が、 $2\theta$  が 9.7 ~ 10.1 度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$  が 14.6

10

20

30

40

50

～ 15.0 度の間（両端の数値を含む）、2θ が 16.8 ～ 17.2 度の間（両端の数値を含む）、2θ が 20.5 ～ 20.9 度の間（両端の数値を含む）、および 2θ が 21.3 ～ 21.7 度の間（両端の数値を含む）のピークを含む XRPD パターンを有する結晶形態にある、項目 1 に記載の方法。

（項目 26）

化合物（1）が、2θ が 9.3 ～ 9.7 度の間（両端の数値を含む）、2θ が 10.6 ～ 11.0 度の間（両端の数値を含む）、2θ が 13.0 ～ 13.4 度の間（両端の数値を含む）、2θ が 18.7 ～ 19.1 度の間（両端の数値を含む）、および 2θ が 21.4 ～ 21.8 度の間（両端の数値を含む）のピークを含む XRPD パターンを有する結晶形態にある、項目 1 に記載の方法。

10

（項目 27）

前記被験体が処置ナীবである、項目 1 ～ 26 のいずれか 1 項に記載の方法。

（項目 28）

前記被験体が、前記初期処置コースの開始前に、さらなる抗うつ病薬を少なくとも 60 日間安定的に服用している、項目 1 ～ 26 のいずれか 1 項に記載の方法。

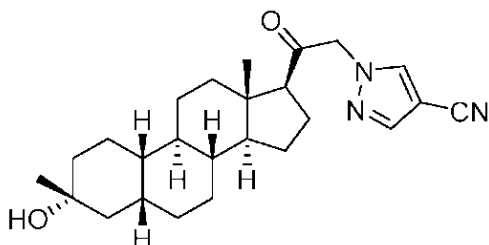
（項目 29）

大うつ病性障害（MDD）を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害（MDD）を処置する方法であって、

（i）治療有効量の化合物（1）；

【化 41】

20



化合物 (1)

の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

30

（ii）0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて治療有効量の化合物（1）を投与することを含む、実施すること

を含み、

ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から 12 ヶ月間にわたって実施し、

前記被験体が処置ナীবである、方法。

（項目 30）

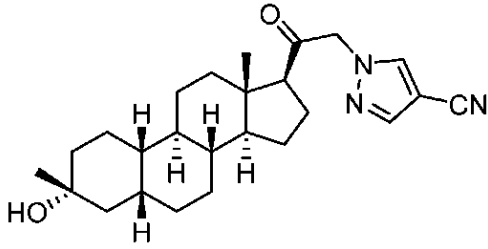
大うつ病性障害（MDD）を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害（MDD）を処置する方法であって、

40

（i）治療有効量の化合物（1）；

50

## 【化 4 2】



化合物 (1)

10

の薬学的に許容され得る塩の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

( i i ) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて治療有効量の化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を投与することを、実施すること

を含み、

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを、前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施し、

前記被験体が処置ナীবである、方法。

(項目31)

20

0または1回のその後の処置コースを実施する、項目29または項目30に記載の方法。

(項目32)

1回のその後の処置コースを実施する、項目29または項目30に記載の方法。

(項目33)

前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、少なくとも約4週間、少なくとも約6週間、または少なくとも約8週間の間隔をあける、項目29~32のいずれか1項に記載の方法。

(項目34)

前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、約4週間、約6週間、または約8週間の間隔をあける、項目29~32のいずれか1項に記載の方法。

30

(項目35)

うつ病症状の前記再発を、ハミルトンうつ病評価尺度(HAM-D)、モントゴメリー-アスベルグうつ病評価尺度(MADRS)、患者健康状態質問票(PHQ-9)、またはこれらの組み合わせを使用した前記被験体の評価によって示す、項目29~34のいずれか1項に記載の方法。

(項目36)

前記被験体におけるうつ病症状の前記再発を、10もしくはそれを超えるPHQ-9スコアまたは20もしくはそれを超えるHAM-Dスコアによって示す、項目29~35のいずれか1項に記載の方法。

(項目37)

40

前記初期処置コースの期間が、約2週間または約14日間である、項目29~36のいずれか1項に記載の方法。

(項目38)

各々のその後の処置コースの期間が、約2週間または約14日間である、項目29~37のいずれか1項に記載の方法。

(項目39)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、前記初期処置コースにおいて、約14日間、1日に1回投与する、項目29~38のいずれか1項に記載の方法。

(項目40)

50

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、各々のその後の処置コースにおいて、約14日間、1日に1回投与する、項目29~39のいずれか1項に記載の方法。

(項目41)

化合物(1)を、約20mg~約55mgの用量で投与する、項目29に記載の方法。

(項目42)

化合物(1)を、約50mgの用量で投与する、項目29に記載の方法。

(項目43)

化合物(1)を、約40mgの用量で投与する、項目29に記載の方法。

(項目44)

化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、約20mg~約55mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与する、項目30に記載の方法。

(項目45)

化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、約50mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与する、項目30に記載の方法。

(項目46)

化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、約40mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与する、項目30に記載の方法。

(項目47)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、経口、非経口、皮内、髄腔内、筋肉内、皮下、膈、頬側として、舌下、直腸、局所、吸入として、鼻腔内、または経皮に投与する、項目29~46のいずれか1項に記載の方法。

(項目48)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、経口投与する、項目47に記載の方法。

(項目49)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を食物とともに投与する、項目29~48のいずれか1項に記載の方法。

(項目50)

化合物(1)または化合物(1)の前記薬学的に許容され得る塩を、夜間に1日1回投与する、項目29~49のいずれか1項に記載の方法。

(項目51)

化合物(1)が、 $2\theta$ が9.7~10.1度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が11.6~12.0度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が13.2~13.6度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が14.2~14.6度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が14.6~15.0度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が16.8~17.2度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が20.5~20.9度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が21.3~21.7度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が21.4~21.8度の間(両端の数値を含む)、および $2\theta$ が22.4~22.8度の間(両端の数値を含む)のピークを含むXRPDパターンを有する結晶形態にある、項目29に記載の方法。

(項目52)

化合物(1)が、 $2\theta$ が9.3~9.7度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が10.6~11.0度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が13.0~13.4度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が14.7~15.1度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が15.8~16.2度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が18.1~18.5度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が18.7~19.1度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が20.9~21.3度の間(両端の数値を含む)、 $2\theta$ が21.4~21.8度の間(両端の数値を含む)、および $2\theta$ が23.3~23.7度の間(両端の数値を含む)のピークを含むXRPDパターンを有する結晶形態にある、項目29に記載の方法。

(項目53)

10

20

30

40

50

化合物(1)が、2θが9.7~10.1度の間(両端の数値を含む)、2θが14.6~15.0度の間(両端の数値を含む)、2θが16.8~17.2度の間(両端の数値を含む)、2θが20.5~20.9度の間(両端の数値を含む)、および2θが21.3~21.7度の間(両端の数値を含む)のピークを含むXRPDパターンを有する結晶形態にある、項目29に記載の方法。

(項目54)

化合物(1)が、2θが9.3~9.7度の間(両端の数値を含む)、2θが10.6~11.0度の間(両端の数値を含む)、2θが13.0~13.4度の間(両端の数値を含む)、2θが18.7~19.1度の間(両端の数値を含む)、および2θが21.4~21.8度の間(両端の数値を含む)のピークを含むXRPDパターンを有する結晶形態にある、項目29に記載の方法。

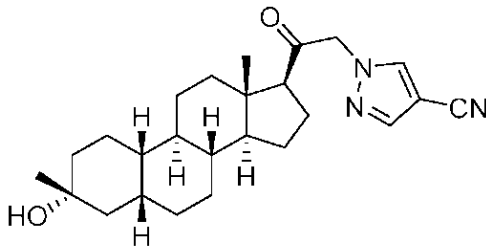
10

(項目55)

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置する方法であって、

(i) 約30mg~約50mgの化合物(1)；

【化43】



20

化合物(1)

の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約30mg~約50mgの化合物(1)を前記被験体に投与することを含む、実施すること

30

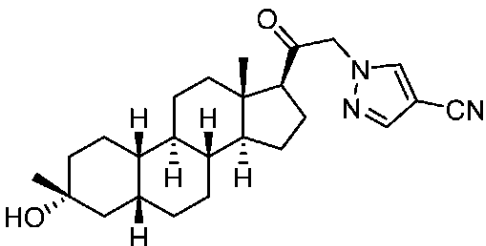
を含み、ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

(項目56)

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置する方法であって、

(i) 約30mg~約50mgの遊離塩基化合物に等価な用量での、化合物(1)；

【化44】



40

化合物(1)

の薬学的に許容され得る塩の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、約30mg~約50mgの前記遊離塩基化合物に等価

50

な用量で、うつ病症状の再発に応じて化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を前記被験体に投与することを含み、実施すること

を含み、

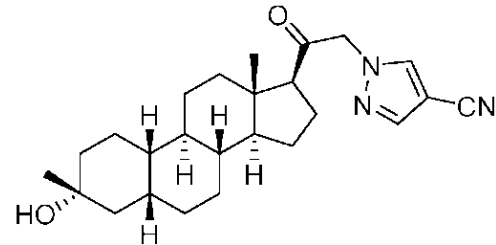
ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

(項目57)

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置する方法であって、

(i)約30mg~約50mgの化合物(1)：

【化45】



化合物(1)

の薬学的に許容され得る塩の約14日間、1日に1回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii)0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約30mg~約50mgの化合物(1)を前記被験体に約14日間、1日に1回投与することを含み、実施すること

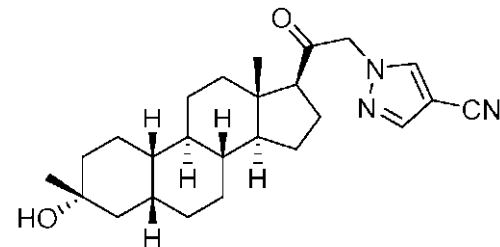
を含み、ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

(項目58)

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置する方法であって、

(i)約30mg~約50mgの遊離塩基化合物に等価な用量での、化合物(1)：

【化46】



化合物(1)

の薬学的に許容され得る塩の約14日間、1日に1回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii)0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、約30mg~約50mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量で、うつ病症状の再発に応じて化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を前記被験体に約14日間、1日に1回投与することを含み、実施すること

を含み、

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

10

20

30

40

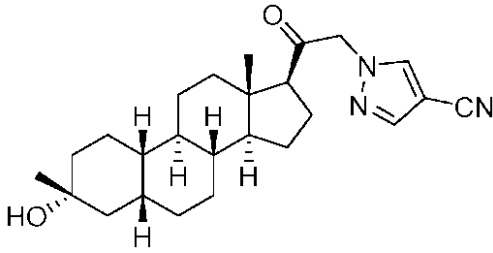
50

(項目 59)

大うつ病性障害 (MDD) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 (MDD) を処置する方法であって、

(i) 約 30 mg ~ 約 50 mg の化合物 (1) :

【化 47】



化合物(1)

10

の約 14 日間にわたる 1 日に 1 回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること ; および

(ii) 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて、約 30 mg ~ 約 50 mg の化合物 (1) を、約 14 日間、1 日に 1 回前記被験体に投与することを含み、但し、前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、少なくとも約 6 週間の間隔をあける、実施すること

20

を含み、

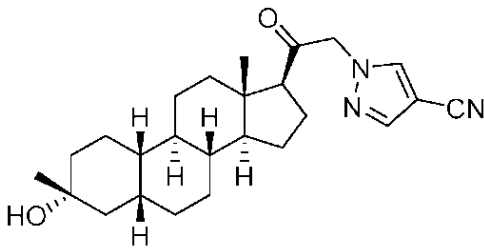
ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースを、前記初期処置コースの開始から 12 ヶ月間にわたって実施する、方法。

(項目 60)

大うつ病性障害 (MDD) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 (MDD) を処置する方法であって、

(i) 約 30 mg ~ 約 50 mg の遊離塩基化合物に等価な用量での、化合物 (1) :

【化 48】



化合物(1)

30

の薬学的に許容され得る塩の約 14 日間、1 日に 1 回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること ; および

40

(ii) 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、約 30 mg ~ 約 50 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量で、うつ病症状の再発に応じて化合物 (1) の薬学的に許容され得る塩を前記被験体に約 14 日間、1 日に 1 回投与することを含み、但し、前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、少なくとも約 6 週間の間隔をあける、実施すること

を含み、

ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から 12 ヶ月間にわたって実施する、方法。

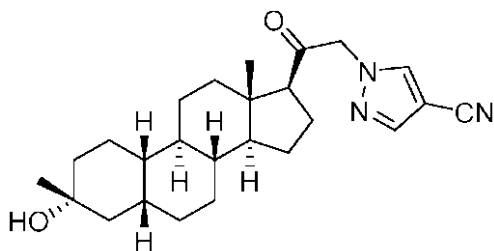
(項目 61)

50

大うつ病性障害 (MDD) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 (MDD) を処置する方法であって、

( i ) 約 30 mg ~ 約 50 mg の化合物 ( 1 ) :

【化 49】



化合物 (1)

10

の約 14 日間、1 日に 1 回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

( ii ) 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約 30 mg ~ 約 50 mg の化合物 ( 1 ) を前記被験体に約 14 日間、1 日に 1 回投与することを含む、実施することを含み、

ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から 12 ヶ月間にわたって実施し、

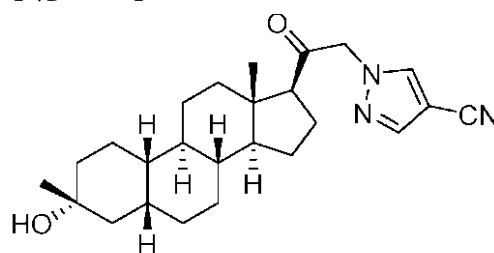
20

前記被験体が、さらなる抗うつ病薬を少なくとも 60 日間安定的に服用している、方法。(項目 62)

大うつ病性障害 (MDD) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 (MDD) を処置する方法であって、

( i ) 約 30 mg ~ 約 50 mg の遊離塩基化合物に等価な用量での、化合物 ( 1 ) :

【化 50】



化合物 (1)

30

の薬学的に許容され得る塩の約 14 日間、1 日に 1 回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

( ii ) 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、約 30 mg ~ 約 50 mg の前記遊離塩基化合物に等価な用量で、うつ病症状の再発に応じて化合物 ( 1 ) の薬学的に許容され得る塩を前記被験体に約 14 日間、1 日に 1 回投与することを含む、実施することを含み、

40

ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から 12 ヶ月間にわたって実施し、

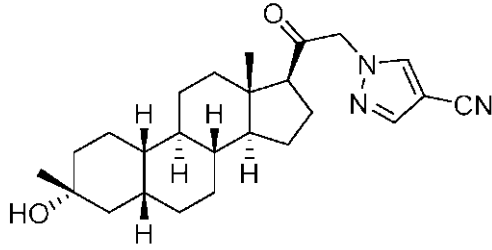
前記被験体が、さらなる抗うつ病薬を少なくとも 60 日間安定的に服用している、方法。(項目 63)

大うつ病性障害 (MDD) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 (MDD) を処置する方法であって、

( i ) 約 45 mg ~ 約 55 mg の化合物 ( 1 ) :

50

## 【化 5 1】



化合物(1)

10

の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

( i i ) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約 4 5 m g ~ 約 5 5 m g の化合物 ( 1 ) を前記被験体に投与することを含む、実施すること  
を含み、

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

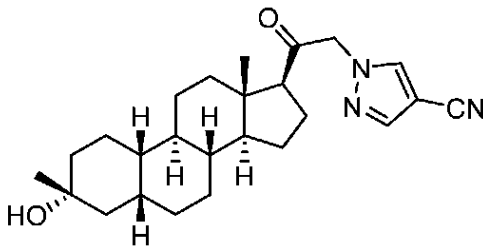
( 項目 6 4 )

大うつ病性障害 ( M D D ) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 ( M D D ) を処置する方法であって、

20

( i ) 約 4 5 m g ~ 約 5 5 m g の遊離塩基化合物に等価な用量での、化合物 ( 1 ) ；

## 【化 5 2】



化合物(1)

30

の薬学的に許容され得る塩の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

( i i ) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、約 4 5 m g ~ 約 5 5 m g の前記遊離塩基化合物に等価な用量で、うつ病症状の再発に応じて化合物 ( 1 ) の薬学的に許容され得る塩を前記被験体に投与することを含む、実施すること  
を含み、

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

40

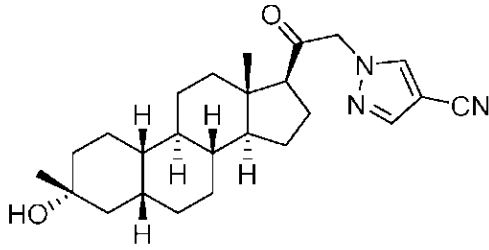
( 項目 6 5 )

大うつ病性障害 ( M D D ) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 ( M D D ) を処置する方法であって、

( i ) 約 4 5 m g ~ 約 5 5 m g の化合物 ( 1 ) ；

50

## 【化53】



化合物(1)

10

の約14日間、1日に1回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて約45mg～約55mgの化合物(1)を前記被験体に約14日間、1日に1回投与することを含む、実施すること

を含み、ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

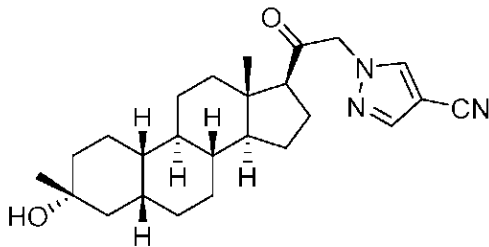
(項目66)

20

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置する方法であって、

(i) 約45mg～約55mgの遊離塩基化合物に等価な用量での、化合物(1)；

## 【化54】



化合物(1)

30

の薬学的に許容され得る塩の約14日間、1日に1回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

(ii) 0、1、または2回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、約45mg～約55mgの前記遊離塩基化合物に等価な用量で、うつ病症状の再発に応じて化合物(1)の薬学的に許容され得る塩を前記被験体に約14日間、1日に1回投与することを含む、実施すること

を含み、

40

ここで、前記0、1、または2回のその後の処置コースを前記初期処置コースの開始から12ヶ月間にわたって実施する、方法。

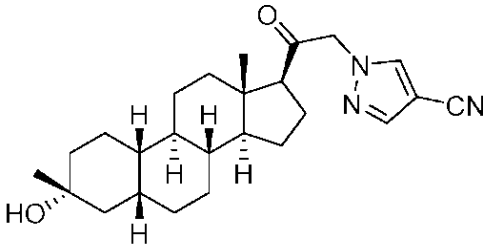
(項目67)

大うつ病性障害(MDD)を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害(MDD)を処置する方法であって、

(i) 約45mg～約55mgの化合物(1)；

50

【化 5 5】



化合物 (1)

10

の約 1 4 日間にわたる 1 日に 1 回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

( i i ) 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて、約 4 5 m g ~ 約 5 5 m g の化合物 ( 1 ) を、約 1 4 日間、1 日に 1 回前記被験体に投与することを含み、但し、前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、少なくとも約 6 週間の間隔をあける、実施すること

を含み、

ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースを、前記初期処置コースの開始から 1 2 ヶ月間にわたって実施する、方法。

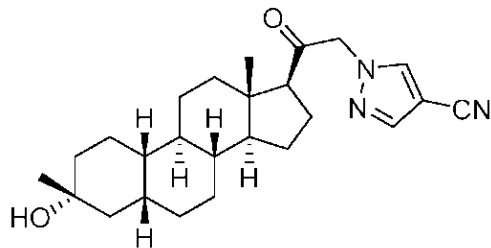
20

( 項目 6 8 )

大うつ病性障害 ( M D D ) を処置することを必要とする被験体において大うつ病性障害 ( M D D ) を処置する方法であって、

( i ) 約 4 5 m g ~ 約 5 5 m g の前記遊離塩基化合物に等価な用量での化合物 ( 1 ) ；

【化 5 6】



化合物 (1)

30

の薬学的に許容され得る塩の約 1 4 日間にわたる 1 日に 1 回の投与を含む初期処置コースを前記被験体を実施すること；および

( i i ) 0、1、または 2 回のその後の処置コースを前記被験体を実施することであって、各々のその後の処置コースが、うつ病症状の再発に応じて、約 4 5 m g ~ 約 5 5 m g の前記遊離塩基化合物に等価な用量で、化合物 ( 1 ) の薬学的に許容され得る塩を、約 1 4 日間、1 日に 1 回前記被験体に投与することを含み、但し、前記初期処置コースの終了と前記その後の処置コースの開始との間に、少なくとも約 6 週間の間隔をあける、実施すること

40

を含み、

ここで、前記 0、1、または 2 回のその後の処置コースを、前記初期処置コースの開始から 1 2 ヶ月間にわたって実施する、方法。

( 項目 6 9 )

0 または 1 回のその後の処置コースを実施する、項目 5 5 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

( 項目 7 0 )

うつ病症状の前記再発を、ハミルトンうつ病評価尺度 ( H A M - D )、モントゴメリー -

50

アスベルグうつ病評価尺度 ( M A D R S )、患者健康状態質問票 ( P H Q - 9 )、またはこれらの組み合わせを使用した前記被験体の評価によって示す、項目 5 5 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

( 項目 7 1 )

前記被験体におけるうつ病症状の前記再発を、1 0 もしくはそれを超える P H Q - 9 スコアまたは 2 0 もしくはそれを超える H A M - D スコアによって示す、項目 5 5 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

( 項目 7 2 )

化合物 ( 1 ) を、約 5 0 m g の用量で投与する、または化合物 ( 1 ) の前記薬学的に許容され得る塩を、約 5 0 m g の前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与する、項目 5 5 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

10

( 項目 7 3 )

化合物 ( 1 ) を、約 4 0 m g の用量で投与し、化合物 ( 1 ) の前記薬学的に許容され得る塩を、約 4 0 m g の前記遊離塩基化合物に等価な用量で投与する、項目 5 5 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

( 項目 7 4 )

化合物 ( 1 ) または化合物 ( 1 ) の前記薬学的に許容され得る塩を、経口、非経口、皮内、髄腔内、筋肉内、皮下、膈、頬側として、舌下、直腸、局所、吸入として、鼻腔内、または経皮に投与する、項目 5 5 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

( 項目 7 5 )

20

化合物 ( 1 ) または化合物 ( 1 ) の前記薬学的に許容され得る塩を、経口投与する、項目 7 4 に記載の方法。

( 項目 7 6 )

化合物 ( 1 ) または化合物 ( 1 ) の前記薬学的に許容され得る塩を食物とともに投与する、項目 5 5 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

( 項目 7 7 )

化合物 ( 1 ) または化合物 ( 1 ) の前記薬学的に許容され得る塩を、夜間に 1 日 1 回投与する、項目 5 5 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

( 項目 7 8 )

前記被験体が処置ナীবである、項目 5 5 ~ 6 0 および 6 3 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

30

40

50