

【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20年3月6日(2008.3.6)

【公表番号】特表2007-522147(P2007-522147A)

【公表日】平成19年8月9日(2007.8.9)

【年通号数】公開・登録公報2007-030

【出願番号】特願2006-552169(P2006-552169)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/255	(2006.01)
A 6 1 P	1/14	(2006.01)
A 6 1 P	13/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
C 0 7 C	315/06	(2006.01)
C 0 7 C	317/44	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/255
A 6 1 P	1/14
A 6 1 P	13/02
A 6 1 P	15/08
A 6 1 P	21/00
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	25/14
A 6 1 P	25/16
A 6 1 P	25/20
C 0 7 C	315/06
C 0 7 C	317/44

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月18日(2008.1.18)

【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 : 1 の R - ( - ) - モダフィニル : S - ( + ) - モダフィニルを含んでなる組成物。

【請求項2】

( a ) 組成物が 2 - シータ角により表されるピークを含んでなる粉末 X - 線回折パターンを特徴とし、ここで：

( i ) 該組成物が 2 : 1 の R - ( - ) - モダフィニル : S - ( + ) - モダフィニルであり、そして該 X 線回折パターンが 8 . 9 7 、 1 0 . 1 5 および 2 0 . 3 9 度のピークを含んでなる；

( i i ) 該組成物が 2 : 1 の R - ( - ) - モダフィニル : S - ( + ) - モダフィニルで

あり、そして該X線回折パターンが8.97および18.19度のピークを含んでなる；  
(i i i) 該組成物が2:1のR-( - )-モダフィニル:S-( + )-モダフィニルであり、そして該X線回折パターンが10.15および20.39度のピークを含んでなる；

(i v) 該組成物が2:1のR-( - )-モダフィニル:S-( + )-モダフィニルであり、そして該X線回折パターンが15.77および19.25度のピークを含んでなる；もしくは

(v) 該組成物が2:1のR-( - )-モダフィニル:S-( + )-モダフィニルであり、そして該X線回折パターンが8.97度のピークを含んでなる；または  
(b) 組成物がDSCサーモグラムを特徴とし、ここで該組成物が2:1のR-( - )-モダフィニル:S-( + )-モダフィニルであり、そして該DSCサーモグラムが約16.7度Cの吸熱転移を含んでなる、

請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

組成物が製薬学的組成物である請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

R-( - )-モダフィニルII形を含んでなる組成物。

【請求項5】

(a) 組成物が多形であり、そして2-シータ角により表されるピークを含んでなる粉末X線回折パターンを特徴とし、ここで：

(i) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが7.21、10.37および17.73度のピークを含んでなる；

(i i) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが7.21および10.37度のピークを含んでなる；

(i i i) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが17.73および19.23度のピークを含んでなる；

(i v) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが10.37および21.77度のピークを含んでなる；もしくは

(v) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが7.21度のピークを含んでなる；または

(b) 組成物がDSCサーモグラムを特徴とし、ここで該組成物がモダフィニル多形であり、そして該DSCサーモグラムが約16.1度Cの吸熱転移を含んでなる、

請求項4に記載の組成物。

【請求項6】

組成物が製薬学的組成物である請求項4に記載の組成物。

【請求項7】

R-( - )-モダフィニルV形を含んでなる組成物。

【請求項8】

組成物が多形であり、そして2-シータ角により表されるピークを含んでなる粉末X線回折パターンを特徴とし、ここで：

(a) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが6.61、10.39および16.49度のピークを含んでなる；

(b) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが6.61および10.39度のピークを含んでなる；

(c) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが13.99および17.73度のピークを含んでなる；もしくは

(d) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが20.87および22.31度のピークを含んでなる；もしくは

(e) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該X線回折パターンが6.61度のピークを含んでなる、

請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

組成物が製薬学的組成物である請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 10】

R - ( - ) - モダフィニル I V 形を含んでなる組成物。

【請求項 11】

( a ) 組成物が多形であり、そして 2 - シータ角により表されるピークを含んでなる粉末 X 線回折パターンを特徴とし、ここで：

( i ) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該 X 線回折パターンが 7 . 7 9 、 1 0 . 3 1 および 1 1 . 7 7 度のピークを含んでなる；

( i i ) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該 X 線回折パターンが 7 . 7 9 および 1 0 . 3 1 度のピークを含んでなる；

( i i i ) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該 X 線回折パターンが 1 6 . 4 9 および 1 7 . 3 3 度のピークを含んでなる；

( i v ) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該 X 線回折パターンが 1 9 . 4 7 および 2 3 . 5 1 度のピークを含んでなる；もしくは

( v ) 該組成物がモダフィニル多形であり、そして該 X 線回折パターンが 7 . 7 9 度のピークを含んでなる；または

( b ) 組成物が D S C サーモグラムを特徴とし、ここで組成物がモダフィニル多形であり、そして

該 D S C サーモグラムが約 1 4 7 度 C の吸熱転移を含んでなる、

請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

組成物が製薬学的組成物である請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 13】

( a ) R - ( - ) - モダフィニルを準備し；そして

( b ) R - ( - ) - モダフィニルの多形を適切な溶媒から結晶化する、  
ことを含んでなる R - ( - ) - モダフィニルの多形の作成方法。

【請求項 14】

( a ) R - ( - ) - モダフィニルおよびモダフィニルの S - 異性体形を準備し；そして

( b ) 2 : 1 の R - ( - ) - モダフィニル : S - ( + ) - モダフィニルを溶媒もしくは  
溶媒混合物から結晶化する、

ことを含んでなる 2 : 1 の R - ( - ) - モダフィニル : S - ( + ) - モダフィニルの作成  
方法。

【請求項 15】

( a ) R - ( - ) - モダフィニルを準備し；そして

( b ) R - ( - ) - モダフィニル I I I 形を溶媒もしくは溶媒混合物から結晶化する、  
ことを含んでなる R - ( - ) - モダフィニル I I I 形の作成方法。

【請求項 16】

( a ) R - ( - ) - モダフィニルを準備し；そして

( b ) R - ( - ) - モダフィニル I V 形を溶媒もしくは溶媒混合物から結晶化する、  
ことを含んでなる R - ( - ) - モダフィニル I V 形の作成方法。

【請求項 17】

( a ) R - ( - ) - モダフィニルを準備し；そして

( b ) R - ( - ) - モダフィニル V 形を溶媒もしくは溶媒混合物から結晶化する、  
ことを含んでなる R - ( - ) - モダフィニル V 形の作成方法。

【請求項 18】

上記組成物がさらに希釈剤、賦形剤または担体を含んでなる請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 19】

上記組成物が製薬学的組成物である請求項 18 に記載の組成物。

**【請求項 2 0】**

R - ( - ) - モダフィニルの I I I 形、 I V 形または V 形を有効成分として含んでなる、ナルコレプシーに伴う過剰な日中の眠気、ナルコレプシー、多発性硬化症に関連する疲労、不妊症、摂食障害、注意欠陥過活動性障害( A D H D )、パーキンソン病、失禁、睡眠時無呼吸、またはミオパシーに罹患している個体の処置用の製薬学的製剤。

**【請求項 2 1】**

個体がヒト個体である請求項 2 0 に記載の製剤。

**【請求項 2 2】**

有効成分が、 R - ( - ) - モダフィニル I I I 形である、請求項 2 0 に記載の製剤。

**【請求項 2 3】**

溶媒分子がクロロホルム、クロロベンゼンおよび酢酸からなる群から選択される、R - ( - ) - モダフィニルの溶媒和物。

**【請求項 2 4】**

溶媒和物が 2 - シータ角により表されるピークを含んでなる粉末 X 線回折パターンを特徴とし、ここで：

( a ) 該溶媒和物がクロロホルム溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 8 . 9 7 、 1 2 . 0 7 および 1 4 . 2 0 度のピークを含んでなる；

( b ) 該溶媒和物がクロロホルム溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 1 7 . 4 9 、 1 8 . 5 6 および 2 0 . 8 7 度のピークを含んでなる；

( c ) 該溶媒和物がクロロホルム溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 8 . 9 7 および 1 2 . 0 7 度のピークを含んでなる；または

( d ) 該溶媒和物がクロロホルム溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 2 0 . 8 7 および 2 3 . 1 1 度のピークを含んでなる；または

( e ) 該溶媒和物がクロロホルム溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 8 . 9 7 度のピークを含んでなる、

請求項 2 3 に記載の溶媒和物。

**【請求項 2 5】**

溶媒和物が 2 - シータ角により表されるピークを含んでなる粉末 X 線回折パターンを特徴とし、ここで：

( a ) 該溶媒和物がクロロベンゼン溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 4 . 5 1 、 6 . 2 5 および 7 . 7 7 度のピークを含んでなる；

( b ) 該溶媒和物がクロロベンゼン溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 1 0 . 3 7 、 1 6 . 6 1 および 1 7 . 9 5 度のピークを含んでなる；

( c ) 該溶媒和物がクロロベンゼン溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 4 . 5 1 および 7 . 7 7 度のピークを含んでなる；または

( d ) 該溶媒和物がクロロベンゼン溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 1 0 . 3 7 および 1 7 . 9 5 度のピークを含んでなる；または

( e ) 該溶媒和物がクロロベンゼン溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 4 . 5 1 度のピークを含んでなる、

請求項 2 3 に記載の溶媒和物。

**【請求項 2 6】**

溶媒和物が 2 - シータ角により表されるピークを含んでなる粉末 X 線回折パターンを特徴とし、ここで：

( a ) 該溶媒和物が酢酸溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 9 . 1 7 、 1 0 . 2 0 および 1 6 . 6 1 度のピークを含んでなる；

( b ) 該溶媒和物が酢酸溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 6 . 5 3 、 6 . 9 4 および 1 7 . 5 9 度のピークを含んでなる；

( c ) 該溶媒和物が酢酸溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 9 . 1 7 および 1 0 . 2 0 度のピークを含んでなる；または

( d ) 該溶媒和物が酢酸溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 1 6 . 6 1 およ

び 17.59 度のピークを含んでなる；または

(e) 該溶媒和物が酢酸溶媒和物であり、そして該 X 線回折パターンが 9.17 度のピークを含んでなる、

請求項 23 に記載の溶媒和物。

【請求項 27】

有効成分が、R-( - )-モダフィニルIV形である、請求項 20 に記載の製剤。

【請求項 28】

有効成分が、R-( - )-モダフィニルV形である、請求項 20 に記載の製剤。

【請求項 29】

有効成分として、R-( - )-モダフィニルV形を含んでなるナルコプシーに伴う過剰な日中の眠気、ナルコプシーまたは睡眠時無呼吸症に罹患している個体の処置用の製薬学的製剤。

【請求項 30】

有効成分として、R-( - )-モダフィニルV形を含んでなる注意欠陥過活動性障害(ADHD)に罹患している個体の処置用の製薬学的製剤。