

【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2年11月12日(2020.11.12)

【公表番号】特表2019-529502(P2019-529502A)

【公表日】令和1年10月17日(2019.10.17)

【年通号数】公開・登録公報2019-042

【出願番号】特願2019-517827(P2019-517827)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/17	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	1/14	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/30	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/17	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	25/20	
A 6 1 P	1/14	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	25/30	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	47/38	

【手続補正書】

【提出日】令和2年9月28日(2020.9.28)

【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】

治療有効量のSYN120またはその医薬的に許容される塩を含む錠剤であつて、ラクトースを実質的に含まない、前記錠剤。

【請求項2】

スクロース、トレハロース、マルトース、イソマルトース、マルツロース、イソマルツロース、ツラノース、及びセロビオースからなる群から選択されるラクトースの異性体を実質的に含まない、請求項1に記載の錠剤。

【請求項3】

ラクトースの全ての異性体を実質的に含まない、請求項1に記載の錠剤。

【請求項4】

ガラクトース、グルコース、フルクトース、リボース、キシロース、及びこれらの異性体からなる群から選択される還元糖を実質的に含まない、請求項3に記載の錠剤。

【請求項5】

いかなる還元糖もその異性体も実質的に含まない、請求項4に記載の錠剤。

【請求項6】

約2.5mgから約200mgのSYN120またはその医薬的に許容される塩を含む、請求項1に記載の錠剤。

【請求項7】

約50mgから約100mgのSYN120またはその医薬的に許容される塩を含む、請求項1に記載の錠剤。

【請求項8】

約5mgから約15mgのSYN120またはその医薬的に許容される塩を含む、請求項1に記載の錠剤。

【請求項9】

即放性錠剤である、請求項1に記載の錠剤。

【請求項10】

USP I Iパドル装置を用いて75rpmの速度にて、37における900mLのpH1.2の塩酸(37%v/v)中0.2%w/vのラウリル硫酸ナトリウム(SLS)中で溶解の試験を行ったときに、60分以内に少なくとも約90%の前記SYN120またはその医薬的に許容される塩が放出される、請求項1に記載の錠剤。

【請求項11】

USP I Iパドル装置を用いて75rpmの速度にて、37における900mLのpH1.2の塩酸(37%v/v)中0.2%w/vのラウリル硫酸ナトリウム(SLS)中で溶解の試験を行ったときに、30分以内に少なくとも約80%の前記SYN120またはその医薬的に許容される塩が放出される、請求項1に記載の錠剤。

【請求項12】

USP I Iパドル装置を用いて75rpmの速度にて、37における900mLのpH1.2の塩酸(37%v/v)中0.2%w/vのラウリル硫酸ナトリウム(SLS)中で溶解の試験を行ったときに、15分以内に少なくとも約70%の前記SYN120またはその医薬的に許容される塩が放出される、請求項1に記載の錠剤。

【請求項13】

マンニトールを実質的に含まない、請求項1に記載の錠剤。

【請求項14】

マンニトールの全ての異性体を実質的に含まない、請求項1に記載の錠剤。

【請求項15】

ソルビトール、キシリトール、エリスリトール、ラクチトール、及びマルチトールからなる群から選択される化合物を実質的に含まない、請求項1に記載の錠剤。

【請求項16】

約4kPaから約15kPaの平均錠剤硬度を有する、請求項1に記載の錠剤。

【請求項17】

微結晶性セルロースをさらに含む、請求項1に記載の錠剤。

【請求項18】

前記微結晶性セルロースが、約20μmから約180μmの公称粒径を有するアルファ-セルロースの部分解重合により調製された微結晶性セルロースである、請求項17に記載の錠剤。

【請求項19】

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が約1時間から約4時間の範囲のSYN120の T_{max} をもたらす、請求項1に記載の錠剤。

【請求項20】

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が約1.5時間から約5時間の範囲のSYN120の平均 T_{max} をもたらす、請求項1に記載の錠剤。

【請求項21】

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が、投与1mg当たり約4ng/mLから約6.5ng/mLの範囲のSYN120の平均 C_{max} をもたらす、請求項1に記載の錠剤。

【請求項22】

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が約100ng-hr/mLから約6,000ng-hr/mLの範囲のSYN120の平均AUC₀₋₂₄をもたらす、請求項1に記載の錠剤。

【請求項23】

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が約100ng-hr/mLから約7,500ng-hr/mLの範囲のSYN120の平均AUC_{0-inf}をもたらす、請求項1に記載の錠剤。

【請求項24】

対象における認知状態または認知疾患を処置する方法における使用のための請求項1から23のいずれか1項に記載の錠剤であって、前記方法が前記処置を必要とする対象に、請求項1から23のいずれか1項に記載の錠剤を投与することを含むことを特徴とする、前記錠剤。

【請求項25】

前記対象が、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン病、認知症、レビー小体型認知症、前頭側頭型認知症、ダウン症候群、自閉症、統合失調症に付随する認知障害、多発性硬化症に付随する認知障害、不安、うつ病、躁うつ病、精神異常、てんかん、自閉症、強迫性障害、気分障害、片頭痛、睡眠障害、摂食障害、拒食症、過食症、肥満、パニック発作、アカシジア、注意欠陥多動障害、注意欠陥障害、薬物乱用からの離脱、統合失調症、脊髄外傷に付随する神経障害、頭部損傷に付随する神経障害、脳卒中に付随する神経障害、脳血管疾患に付随する神経障害、ならびに腸機能障害からなる群から選択される疾患または状態を患っている、請求項24に記載の錠剤。

【請求項26】

対象の認知機能を改善する方法における使用のための請求項1から23のいずれか1項に記載の錠剤であって、前記方法が前記改善を必要とする対象に、請求項1から23のいずれか1項に記載の錠剤を投与することを含むことを特徴とする、前記錠剤。

【請求項27】

前記対象がアルツハイマー病と診断されている、請求項26に記載の錠剤。

【請求項28】

前記対象がパーキンソン病と診断されている、請求項26に記載の錠剤。

【請求項 2 9】

前記投与することが、S Y N 1 2 0 の 5 0 m g 錠剤を 1 日 1 回 7 日間投与し、次に S Y N 1 2 0 の 1 0 0 m g 錠剤を 1 日 1 回 7 日間投与し、次に S Y N 1 2 0 の 1 0 0 m g または 2 0 0 m g 錠剤を以後 1 日 1 回投与することを含む、請求項 2 4 に記載の錠剤。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 8】

また、本発明は、患者の認知機能を改善する方法であって、当該改善を必要とする患者に本発明の S Y N 1 2 0 組成物 / 錠剤を投与することを含む、方法も含む。別の実施形態では、患者は、アルツハイマー病と診断されている。別の実施形態では、患者は、パーキンソン病と診断されている。

特定の実施形態では、例えば、以下が提供される：

(項目 1)

治療有効量の S Y N 1 2 0 またはその医薬的に許容される塩を含む錠剤であって、ラクトースを実質的に含まない、前記錠剤。

(項目 2)

スクロース、トレハロース、マルトース、イソマルトース、マルツロース、イソマルツロース、ツラノース、及びセロビオースからなる群から選択されるラクトースの異性体を実質的に含まない、項目 1 に記載の錠剤。

(項目 3)

ラクトースの全ての異性体を実質的に含まない、項目 1 に記載の錠剤。

(項目 4)

ガラクトース、グルコース、フルクトース、リボース、キシロース、及びこれらの異性体からなる群から選択される還元糖を実質的に含まない、項目 3 に記載の錠剤。

(項目 5)

いかなる還元糖もその異性体も実質的に含まない、項目 4 に記載の錠剤。

(項目 6)

約 2 . 5 m g から約 2 0 0 m g の S Y N 1 2 0 またはその医薬的に許容される塩を含む、項目 1 に記載の錠剤。

(項目 7)

約 5 0 m g から約 1 0 0 m g の S Y N 1 2 0 またはその医薬的に許容される塩を含む、項目 1 に記載の錠剤。

(項目 8)

約 5 m g から約 1 5 m g の S Y N 1 2 0 またはその医薬的に許容される塩を含む、項目 1 に記載の錠剤。

(項目 9)

即放性錠剤である、項目 1 に記載の錠剤。

(項目 1 0)

U S P I I パドル装置を用いて 7 5 r p m の速度にて、3 7 における 9 0 0 m L の pH 1 . 2 の塩酸 (3 7 % v / v) 中 0 . 2 % w / v のラウリル硫酸ナトリウム (S L S) 中で溶解の試験を行ったときに、6 0 分以内に少なくとも約 9 0 % の前記 S Y N 1 2 0 またはその医薬的に許容される塩が放出される、項目 1 に記載の錠剤。

(項目 1 1)

U S P I I パドル装置を用いて 7 5 r p m の速度にて、3 7 における 9 0 0 m L の pH 1 . 2 の塩酸 (3 7 % v / v) 中 0 . 2 % w / v のラウリル硫酸ナトリウム (S L S) 中で溶解の試験を行ったときに、3 0 分以内に少なくとも約 8 0 % の前記 S Y N 1 2 0 またはその医薬的に許容される塩が放出される、項目 1 に記載の錠剤。

(項目12)

U S P I I パドル装置を用いて 75 r p m の速度にて、37 における 900 mL の pH 1.2 の塩酸（37% v/v）中 0.2% w/v のラウリル硫酸ナトリウム（SLS）中で溶解の試験を行ったときに、15 分以内に少なくとも約 70% の前記 S Y N 120 またはその医薬的に許容される塩が放出される、項目1に記載の錠剤。

(項目13)

マンニトールを実質的に含まない、項目1に記載の錠剤。

(項目14)

マンニトールの全ての異性体を実質的に含まない、項目1に記載の錠剤。

(項目15)

ソルビトール、キシリトール、エリスリトール、ラクチトール、及びマルチトールからなる群から選択される化合物を実質的に含まない、項目1に記載の錠剤。

(項目16)

約 4 k p から約 15 k p の平均錠剤硬度を有する、項目1に記載の錠剤。

(項目17)

微結晶性セルロースをさらに含む、項目1に記載の錠剤。

(項目18)

前記微結晶性セルロースが、約 20 μm から約 180 μm の公称粒径を有するアルファ-セルロースの部分解重合により調製された微結晶性セルロースである、項目17に記載の錠剤。

(項目19)

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が約1時間から約4時間の範囲の S Y N 120 の T_{max} をもたらす、項目1に記載の錠剤。

(項目20)

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が約1.5時間から約5時間の範囲の S Y N 120 の平均 T_{max} をもたらす、項目1に記載の錠剤。

(項目21)

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が、投与 1 mg 当たり約 4 ng / mL から約 6.5 ng / mL の範囲の S Y N 120 の平均 C_{max} をもたらす、項目1に記載の錠剤。

(項目22)

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が約 100 ng - hr / mL から約 6,000 ng - hr / mL の範囲の S Y N 120 の平均 AUC_{0-24} をもたらす、項目1に記載の錠剤。

(項目23)

患者に1つの錠剤を投与した後に、前記錠剤が約 100 ng - hr / mL から約 7,500 ng - hr / mL の範囲の S Y N 120 の平均 $AUC_{0-infinity}$ をもたらす、項目1に記載の錠剤。

(項目24)

対象における認知状態または認知疾患を処置する方法であって、前記処置を必要とする対象に、項目1から23に記載の錠剤を投与することを含む、前記方法。

(項目25)

前記対象が、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン病、認知症、レビー小体型認知症、前頭側頭型認知症、ダウン症候群、自閉症、統合失調症に付随する認知障害、多発性硬化症に付随する認知障害、不安、うつ病、躁うつ病、精神異常、てんかん、自閉症、強迫性障害、気分障害、片頭痛、睡眠障害、摂食障害、拒食症、過食症、肥満、パニック発作、アカシジア、注意欠陥多動障害、注意欠陥障害、薬物乱用からの離脱、統合失調症、脊髄外傷に付随する神経障害、頭部損傷に付随する神経障害、脳卒中に付随する神経障害、脳血管疾患に付随する神経障害、ならびに腸機能障害からなる群から選択される疾患または状態を患っている、項目24に記載の方法。

(項目26)

対象の認知機能を改善する方法であって、前記改善を必要とする対象に、項目1から23のいずれか1項に記載の錠剤を投与することを含む、前記方法。

(項目27)

前記対象がアルツハイマー病と診断されている、項目26に記載の方法。

(項目28)

前記対象がパーキンソン病と診断されている、項目26に記載の方法。

(項目29)

前記投与することが、S Y N 1 2 0 の 5 0 m g 錠剤を1日1回7日間投与し、次にS Y N 1 2 0 の 1 0 0 m g 錠剤を1日1回7日間投与し、次にS Y N 1 2 0 の 1 0 0 m g または 2 0 0 m g 錠剤を以後1日1回投与することを含む、項目24に記載の方法。