【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1月21日(2025.1.21)

【公開番号】特開2024-38524(P2024-38524A)
【公開日】令和6年3月19日(2024.3.19)
【年通号数】公開公報(特許)2024-051
【出願番号】特願2024-16033(P2024-16033)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ307/14(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/341(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/16(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/14(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ307/14 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/341
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 25/16
Ａ６１Ｐ 25/14
Ａ６１Ｐ 25/00

【手続補正書】
【提出日】令和6年12月27日(2024.12.27)
【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】
テトラヒドロ－Ｎ，Ｎ－ジメチル－２，２－ジフェニル－３－フランメタンアミン（Ａ２－７３）の結晶形態であって、前記結晶形態は、Ａ２－７３リン酸二水素形態Ｉ、Ａ２－７３硫酸塩形態Ｉ、又はＡ２－７３硫酸塩形態ＩＩから選択され、
ここで、前記Ａ２－７３リン酸二水素形態Ｉは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられ：
５．７６、１１．６９、１３．７３、１４．３６、１５．３５、１６．１１、１７．１１、１７．３２、１８．７４、２０．６５、２１．１４、２１．８８、２２．７１、２３．７１、２５．３４、２５．８９、２６．５６、２６．９９、２７．６６、及び２８．９５；
前記Ａ２－７３硫酸塩形態Ｉは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられ：
５．８８、１１．８５、１３．６６、１５．６７、１５．７８、１５．８４、１６．３２、１７.１１、１８．９１、２０．３０、２０．５２、２０．６５、２３．８２、２４．５６、２４.８４、２４．９０、２５．８０、２５．９８、２７．０３、及び２７．５１；
前記Ａ２－７３硫酸塩形態ＩＩは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられる：
１１．５０、１１．６４、１２．０５、１２．１１、１３．３２、１４．７３、１５．５３、１５．８９、１９．６５、１９．７５、２１．１２、２３．８１、２４．００、２４

．０７、２４.３２、２５．４２、２５．６０、２５．６７、２６．４２、及び２６．４８、結晶形態。

【請求項２】

治療有効量のテトラヒドロ－Ｎ，Ｎ－ジメチル－２，２－ジフェニル－３－フランメタンアミン（Ａ２－７３）をＡ２－７３リン酸二水素形態Ｉ、Ａ２－７３硫酸塩形態Ｉ、又はＡ２－７３硫酸塩形態ＩＩから選択される結晶で含む剤形であって、

ここで、前記Ａ２－７３リン酸二水素形態Ｉは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられ：

５．７６、１１．６９、１３．７３、１４．３６、１５．３５、１６．１１、１７．１１、１７．３２、１８．７４、２０．６５、２１．１４、２１．８８、２２．７１、２３．７１、２５．３４、２５．８９、２６．５６、２６．９９、２７．６６、及び２８．９５；

前記Ａ２－７３硫酸塩形態Ｉは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられ：

５．８８、１１．８５、１３．６６、１５．６７、１５．７８、１５．８４、１６．３２、１７.１１、１８．９１、２０．３０、２０．５２、２０．６５、２３．８２、２４．５６、２４.８４、２４．９０、２５．８０、２５．９８、２７．０３、及び２７．５１；

前記Ａ２－７３硫酸塩形態ＩＩは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられる：

１１．５０、１１．６４、１２．０５、１２．１１、１３．３２、１４．７３、１５．５３、１５．８９、１９．６５、１９．７５、２１．１２、２３．８１、２４．００、２４．０７、２４.３２、２５．４２、２５．６０、２５．６７、２６．４２、及び２６．４８、剤形。

【請求項３】

経口投与形態である、請求項２に記載の剤形。

【請求項４】

腸溶性コーティング経口製剤である、請求項２又は請求項３に記載の剤形。

【請求項５】

約５ｍｇ～５０ｍｇのＡ７－７３リン酸二水素形態Ｉを含む経口錠剤；

約５ｍｇ～５０ｍｇのＡ２－７３リン酸二水素形態Ｉを含む腸溶性コーティング経口錠剤；

約５ｍｇ～５０ｍｇのＡ２－７３硫酸塩形態Ｉを含む経口錠剤；

約５ｍｇ～５０ｍｇのＡ２－７３硫酸塩形態Ｉを含む腸溶性コーティング経口錠剤；又は

約５ｍｇ～５０ｍｇのＡ２－７３硫酸塩形態ＩＩを含む腸溶性コーティング経口錠剤である、請求項２～請求項４のいずれか１項に記載の剤形。

【請求項６】

テトラヒドロ－Ｎ，Ｎ－ジメチル－２，２－ジフェニル－３－フランメタンアミン（Ａ２－７３）の送達用医薬製剤であって、

前記医薬製剤は、治療有効量の、Ａ２－７３リン酸二水素形態Ｉ、Ａ２－７３硫酸塩形態Ｉ、又はＡ２－７３硫酸塩形態ＩＩから選択されるＡ２－７３の結晶を含み、

ここで、前記Ａ２－７３リン酸二水素形態Ｉは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられ：

５．７６、１１．６９、１３．７３、１４．３６、１５．３５、１６．１１、１７．１１、１７．３２、１８．７４、２０．６５、２１．１４、２１．８８、２２．７１、２３．７１、２５．３４、２５．８９、２６．５６、２６．９９、２７．６６、及び２８．９５；

前記Ａ２－７３硫酸塩形態Ｉは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられ：

５．８８、１１．８５、１３．６６、１５．６７、１５．７８、１５．８４、１６．３２

、１７.１１、１８．９１、２０．３０、２０．５２、２０．６５、２３．８２、２４．５６、２４.８４、２４．９０、２５．８０、２５．９８、２７．０３、及び２７．５１；
前記Ａ２－７３硫酸塩形態ＩＩは下記のピークを含むＸＲＰＤピークによって特徴付けられる：
１１．５０、１１．６４、１２．０５、１２．１１、１３．３２、１４．７３、１５．５３、１５．８９、１９．６５、１９．７５、２１．１２、２３．８１、２４．００、２４．０７、２４.３２、２５．４２、２５．６０、２５．６７、２６．４２、及び２６．４８、医薬製剤。

【請求項７】
化学増強剤、湿潤剤、感圧接着剤、抗酸化剤、可溶化剤、増粘剤、可塑剤、アジュバント、担体、賦形剤、ビヒクル、及びそれらの任意の組み合わせからなる群から選択される、１以上の薬学的に許容可能な非薬効成分（excipient）をさらに含む、請求項６に記載の医薬製剤。

【請求項８】
前記１以上の非薬効成分（excipient）が、経口投与、経皮投与、非経口投与、腹腔内投与、血管内投与、皮下投与、吸入スプレーによる投与、直腸投与、又は肺内投与用に選択される、請求項６又は請求項７に記載の医薬製剤。

【請求項９】
治療有効量のＡ２－７３が、約１０ｎｇ／ｍｌ又は約１２ｎｇ／ｍｌのＡ２－７３の血液レベルを提供する、請求項６～請求項８のいずれか１項に記載の医薬製剤。

【請求項１０】
経口製剤である、請求項６～請求項９のいずれか１項に記載の医薬製剤。

【請求項１１】
錠剤又はカプセルである、請求項６～請求項１０のいずれか１項に記載の医薬製剤。

【請求項１２】
治療有効量のＡ２－７３が約１～約６０ｍｇ／日である、請求項６～請求項１１に記載のいずれか１項に記載の医薬製剤。

【請求項１３】
アルツハイマー病の治療に使用される、請求項６～請求項１２のいずれか１項に記載の医薬製剤。

【請求項１４】
進行性認知症の治療に使用される、請求項６～請求項１２のいずれか１項に記載の医薬製剤。

【請求項１５】
神経変性疾患の治療に使用される、請求項６～請求項１２のいずれか１項に記載の医薬製剤。

【請求項１６】
前記神経変性疾患が、アルツハイマー病、パーキンソン病、プリオン病、ハンチントン病、運動ニューロン病（ＭＮＤ）、脊髄小脳失調症（ＳＣＡ）、及び脊髄筋萎縮症（ＳＭＡ）からなる群から選択される、請求項１５に記載の医薬製剤。