

【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19日(2020.11.19)

【公表番号】特表2019-530751(P2019-530751A)

【公表日】令和1年10月24日(2019.10.24)

【年通号数】公開・登録公報2019-043

【出願番号】特願2019-540310(P2019-540310)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/05	(2006.01)
A 6 1 K	31/352	(2006.01)
A 6 1 K	36/185	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/05	
A 6 1 K	31/352	
A 6 1 K	36/185	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	43/00	1 2 1

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月9日(2020.10.9)

【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】

(i) カンナビジオール(CBD)及びカンナビノール(CBN)から選択される少なくとも1種の第1の主要カンナビノイド、

(ii) カンナビジバリン(CBDV)、カンナビクロメン(CBC)及びカンナビゲロール(CBG)から選択される少なくとも1種の第1の微量カンナビノイド、並びに

任意選択で、リモネン、リナロール、ネロリドール、ピネン、及びフィトールから選択される少なくとも1種の第1の選択されたテルペン

を含む、薬学的活性成分。

【請求項2】

前記第1の微量カンナビノイドがカンナビジバリンである、請求項1に記載の活性成分。

【請求項3】

第2の微量カンナビノイドを含み、前記第2の微量カンナビノイドがカンナビクロメン(CBC)及びカンナビゲロール(CBG)から選択され、

任意選択で、第3の微量カンナビノイドを含み、前記第3の微量カンナビノイドがカンナビクロメン(CBC)である、請求項2に記載の活性成分。

【請求項4】

少なくとも1種の第1の選択されたテルペン、及び任意選択で第2の選択されたテルペン

を含み、第1の選択されたテルペン、及び任意選択の第2の選択されたテルペンが、独立して、リモネン、リナロール、ネロリドール、ピネン、及びフィトールから選択される、請求項1に記載の活性成分。

【請求項5】

実質的にTHCを含まない、請求項1に記載の活性成分。

【請求項6】

前記主要カンナビノイド、微量カンナビノイド、及び任意選択の選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の少なくとも75重量%、80重量%、85重量%、90重量%、又は95重量%を構成する、請求項1に記載の活性成分。

【請求項7】

前記主要カンナビノイド、前記微量カンナビノイド、及び前記選択されたテルペン以外の前記活性成分における全ての化合物が、カンナビス・サティバから抽出可能である、請求項6に記載の活性成分。

【請求項8】

前記主要カンナビノイドが、合計で前記活性成分の5~40重量%を構成し、
前記微量カンナビノイドが、合計で前記活性成分の5~70重量%を構成し、
前記選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の0~70重量%を構成する、
請求項1に記載の活性成分。

【請求項9】

薬学的活性成分を製造する方法であって、任意の順序で、
少なくとも1種の第1の主要カンナビノイド、
少なくとも1種の第1の微量カンナビノイド、及び
任意選択で、少なくとも1種の第1の選択されたテルペン
を混合するステップを含む、方法。

【請求項10】

前記第1の主要カンナビノイド、前記第1の微量カンナビノイド、及び前記任意選択の第1の選択されたテルペンのうちの少なくとも1種が、カンナビス・サティバ抽出物に加えられ、

任意選択で、主要カンナビノイド、微量カンナビノイド、及び選択されたテルペンの各々のカンナビス・サティバ抽出物における濃度を測定する、先行するステップを含み、
任意選択で、前記カンナビス・サティバ抽出物を調製する先行するステップをさらに含み、前記カンナビス・サティバ抽出物が、前記活性成分の所定の組成に最も近くなるように選択されたカンナビス・サティバ品種から調製される、請求項9に記載の方法。

【請求項11】

前記第1の主要カンナビノイド、前記第1の微量カンナビノイド、又は前記任意選択の第1の選択されたテルペンのうちの少なくとも1種が、前記活性成分における所定の濃度を達成するように加えられる、請求項9に記載の方法。

【請求項12】

請求項1に記載の活性成分、及び少なくとも1種の薬学的に許容される担体又は希釈剤を含み、油剤、乳剤、ゲル剤、又はエアロゾル剤である、医薬組成物。

【請求項13】

吸入による投与、気化器による投与、ネブライザーによる投与、又はエアロゾライザーによる投与のために製剤化されており、

任意選択で、経口投与、口腔投与、舌下投与、静脈内投与、筋肉内投与、皮下投与、髄腔内投与、脳室内投与又は局所投与のために製剤化されている、請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項14】

前記活性成分が、少なくとも0.01mg/ml、少なくとも0.1mg/ml、少なくとも0.5mg/ml、又は少なくとも1mg/mlの濃度で前記医薬組成物に存在する、請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

神経変性疾患を処置する方法に使用するための請求項12から14のいずれか一項に記載の医薬組成物であって、有効量の医薬組成物が神経変性疾患有する患者に投与され、前記神経変性疾患有が、アルツハイマー病、パーキンソン病、レビー小体型認知症、又はハンチントン病からなる群から選択される、医薬組成物。

【請求項 16】

前記医薬組成物が吸入により、経口により、口腔投与により、舌下投与により、注射により、又は局所適用により投与される、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記医薬組成物が、ニューロンの生存又はドーパミン放出をモジュレートするのに十分な量で投与される、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記主要カンナビノイドが、1用量あたり1g未満の量、1用量あたり500mg未満の量、1用量あたり100mg未満の量、又は1用量あたり10mg未満の量で投与される、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記医薬組成物が、必要に応じて投与される、1日に1回投与される、1日に2~4回投与される、1週間に2~4回投与される、1週間に1回投与される、又は2週間に1回投与される、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

パーキンソン病を処置する方法に使用するための医薬組成物であって、有効量の医薬組成物がパーキンソン病を有する患者に投与され、前記医薬組成物が、活性成分として、微量カンナビノイドであるカンナビクロメン、カンナビゲロール及びカンナビジバリント、

選択されたテルペンであるリモネン、リナロール、ネロリドール、ピネン、及びフィトールと、

薬学的に許容される担体又は希釈剤との混合物を含む、医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 9 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 9 6】

7. 等価物

本開示は、とりわけ、カンナビノイド含有複合混合物の組成物を提供する。本開示はまた、カンナビノイド含有複合混合物を投与するステップによって神経変性疾患を処置する方法を提供する。様々な特定の実施形態が例示され、記載されているが、上記明細書は限定的ではない。本発明(複数可)の精神及び範囲から逸脱することなく、様々な変更を行うことができる事が理解されるであろう。本明細書を検討すると、多くの変形例が当業者には明らかになるであろう。

本発明は例えば以下の態様を含む。

[項 1]

少なくとも1種の第1の主要カンナビノイド、
少なくとも1種の第1の微量カンナビノイド、及び
場合により、少なくとも1種の第1の選択されたテルペン
を含む、薬学的活性成分。

[項 2]

前記第1の主要カンナビノイドがカンナビジオール(CBD)である、項1に記載の活性成分。
。

[項 3]

前記第1の主要カンナビノイドがカンナビノール(CBN)である、項1に記載の活性成分。

[項 4]

前記第1の微量カンナビノイドがカンナビジバリンである、項1から3のいずれか一項に記載の活性成分。

[項 5]

第2の微量カンナビノイドを含み、前記第2の微量カンナビノイドがカンナビクロメンである、項4に記載の活性成分。

[項 6]

第2の微量カンナビノイドを含み、前記第2の微量カンナビノイドがカンナビゲロールである、項4に記載の活性成分。

[項 7]

第3の微量カンナビノイドを含み、前記第3の微量カンナビノイドがカンナビクロメンである、項5に記載の活性成分。

[項 8]

少なくとも1種の第1の選択されたテルペンを含む、項1から7のいずれか一項に記載の活性成分。

[項 9]

第2の選択されたテルペンを含む、項8に記載の活性成分。

[項 10]

前記第1及び第2のテルペンがリモネン及びリナロールである、項9に記載の活性成分。

[項 11]

前記第1及び第2のテルペンがピネン及びフィトールである、項9に記載の活性成分。

[項 12]

リモネン、リナロール、ネロリドール、ピネン、及びフィトールを含む、項8に記載の活性成分。

[項 13]

実質的にTHCを含まない、項1から12のいずれか一項に記載の活性成分。

[項 14]

前記主要カンナビノイド、微量カンナビノイド、及び任意の選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の少なくとも75重量%を構成する、項1から13のいずれか一項に記載の活性成分。

[項 15]

前記主要カンナビノイド、微量カンナビノイド、及び任意の選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の少なくとも80重量%を構成する、項14に記載の活性成分。

[項 16]

前記主要カンナビノイド、微量カンナビノイド、及び任意の選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の少なくとも85重量%を構成する、項15に記載の活性成分。

[項 17]

前記主要カンナビノイド、微量カンナビノイド、及び任意の選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の少なくとも90重量%を構成する、項16に記載の活性成分。

[項 18]

前記主要カンナビノイド、微量カンナビノイド、及び任意の選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の少なくとも95重量%を構成する、項17に記載の活性成分。

[項 19]

前記主要カンナビノイド、前記微量カンナビノイド、及び前記選択されたテルペン以外の前記活性成分における全ての化合物が、カンナビス・サティバから抽出可能である、項14から18のいずれか一項に記載の活性成分。

[項 20]

前記主要カンナビノイドが、合計で前記活性成分の5~40重量%を構成し、

前記微量カンナビノイドが、合計で前記活性成分の5~70重量%を構成し、
前記選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の0~70重量%を構成する、
項1から19のいずれか一項に記載の活性成分。

[項 2 1]

前記主要カンナビノイドが、合計で前記活性成分の10~35重量%を構成し、
前記微量カンナビノイドが、合計で前記活性成分の30~70重量%を構成し、
前記選択されたテルペンが、合計で前記活性成分の0~50重量%を構成する、
項20に記載の活性成分。

[項 2 2]

薬学的活性成分を製造する方法であって、任意の順序で、
少なくとも1種の第1の主要カンナビノイド、
少なくとも1種の第1の微量カンナビノイド、及び
場合により、少なくとも1種の第1の選択されたテルペン
を混合するステップを含む、方法。

[項 2 3]

前記第1の主要カンナビノイド、前記第1の微量カンナビノイド、及び前記任意の第1の
選択されたテルペンのうちの少なくとも1種が、カンナビス・サティバ抽出物に加えられる、項22に記載の方法。

[項 2 4]

主要カンナビノイド、微量カンナビノイド、及び選択されたテルペンの各々のカンナビ
ス・サティバ抽出物における濃度を測定する、先行するステップをさらに含む、項23に記
載の方法。

[項 2 5]

前記第1の主要カンナビノイド、前記第1の微量カンナビノイド、又は前記任意の第1の
選択されたテルペンのうちの少なくとも1種が、前記活性成分における所定の濃度を達成
するように加えられる、項22から24のいずれか一項に記載の方法。

[項 2 6]

前記カンナビス・サティバ抽出物を調製する先行するステップをさらに含む、項23から
25のいずれか一項に記載の方法。

[項 2 7]

前記カンナビス・サティバ抽出物が、前記活性成分の所定の組成に最も近くなるように
選択されたカンナビス・サティバ品種から調製される、項26に記載の方法。

[項 2 8]

項22から27のいずれか一項に記載の方法によって生成される、項1から21のいずれか一
項に記載の活性成分。

[項 2 9]

項1から21及び28のいずれか一項に記載の活性成分、及び薬学的に許容される担体又は
希釈剤を含む医薬組成物。

[項 3 0]

油剤である、項29に記載の医薬組成物。

[項 3 1]

乳剤である、項29に記載の医薬組成物。

[項 3 2]

ゲル剤である、項29に記載の医薬組成物。

[項 3 3]

エアロゾル剤である、項29に記載の医薬組成物。

[項 3 4]

吸入による投与のために製剤化されている、項29から33のいずれか一項に記載の医薬組
成物。

[項 3 5]

気化器による投与のために製剤化されている、項29から33のいずれか一項に記載の医薬組成物。

[項 3 6]

ネプライザーによる投与のために製剤化されている、項29から33のいずれか一項に記載の医薬組成物。

[項 3 7]

エアロゾライザーによる投与のために製剤化されている、項29から33のいずれか一項に記載の医薬組成物。

[項 3 8]

経口投与、口腔投与又は舌下投与のために製剤化されている、項29から33のいずれか一項に記載の医薬組成物。

[項 3 9]

静脈内、筋肉内、又は皮下投与のために製剤化されている、項29から33のいずれか一項に記載の医薬組成物。

[項 4 0]

髄腔内又は脳室内投与のために製剤化されている、項29から33のいずれか一項に記載の医薬組成物。

[項 4 1]

局所投与のために製剤化されている、項29から33のいずれか一項に記載の医薬組成物。

[項 4 2]

前記活性成分が、少なくとも $0.01\text{mg}/\text{ml}$ の濃度で前記医薬組成物に存在する、項29から41のいずれか一項に記載の医薬組成物。

[項 4 3]

前記活性成分が、少なくとも $0.1\text{mg}/\text{ml}$ の濃度で前記医薬組成物に存在する、項42に記載の医薬組成物。

[項 4 4]

前記活性成分が、少なくとも $0.5\text{mg}/\text{ml}$ の濃度で前記医薬組成物に存在する、項43に記載の医薬組成物。

[項 4 5]

前記活性成分が、少なくとも $1\text{mg}/\text{ml}$ の濃度で前記医薬組成物に存在する、項44に記載の医薬組成物。

[項 4 6]

神経変性疾患を処置する方法であって、有効量の項29から45のいずれか一項に記載の医薬組成物を、神経変性疾患有する患者に投与するステップを含む、方法。

[項 4 7]

前記神経変性疾患が、アルツハイマー病、パーキンソン病、レビー小体型認知症、又はハンチントン病である、項46に記載の方法。

[項 4 8]

前記神経変性疾患がパーキンソン病である、項47に記載の方法。

[項 4 9]

前記医薬組成物が吸入により投与される、項46から48のいずれか一項に記載の方法。

[項 5 0]

前記医薬組成物が経口により投与される、項46から48のいずれか一項に記載の方法。

[項 5 1]

前記医薬組成物が口腔投与により投与される、項46から48のいずれか一項に記載の方法。

[項 5 2]

前記医薬組成物が舌下投与により送達される、項46から48のいずれか一項に記載の方法。

[項 5 3]

前記医薬組成物が注射により投与される、項46から48のいずれか一項に記載の方法。

[項 5 4]

前記医薬組成物が局所適用により投与される、項46から48のいずれか一項に記載の方法

。

[項 5 5]

前記医薬組成物が、ニューロンの生存又はドーパミン放出をモジュレートするのに十分な量で投与される、項46から54のいずれか一項に記載の方法。

[項 5 6]

前記主要カンナビノイドが、1用量あたり1g未満の量で投与される、項46から55のいずれか一項に記載の方法。

[項 5 7]

前記主要カンナビノイドが、1用量あたり500mg未満の量で投与される、項56に記載の方法。

[項 5 8]

前記主要カンナビノイドが、1用量あたり100mg未満の量で投与される、項57に記載の方法。

[項 5 9]

前記主要カンナビノイドが、1用量あたり10mg未満の量で投与される、項58に記載の方法。

[項 6 0]

前記医薬組成物が、必要に応じて投与される、項46から59のいずれか一項に記載の方法

。

[項 6 1]

前記医薬組成物が、1日に1回投与される、項46から59のいずれか一項に記載の方法。

[項 6 2]

前記医薬組成物が、1日に2～4回投与される、項46から59のいずれか一項に記載の方法

。

[項 6 3]

前記医薬組成物が、1週間に2～4回投与される、項46から59のいずれか一項に記載の方法。

[項 6 4]

前記医薬組成物が、1週間に1回投与される、項46から59のいずれか一項に記載の方法。

[項 6 5]

前記医薬組成物が、2週間に1回投与される、項46から59のいずれか一項に記載の方法。