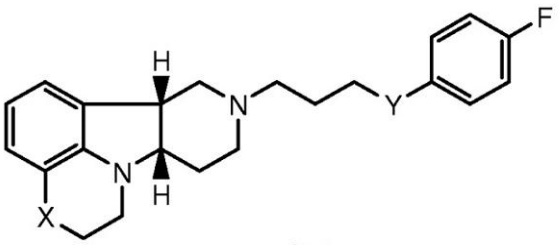
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和3年7月26日(2021.7.26)

【公開番号】特開2021-75566(P2021-75566A)
【公開日】令和3年5月20日(2021.5.20)
【年通号数】公開・登録公報2021-023
【出願番号】特願2021-21096(P2021-21096)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/4985　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/20　 (2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/48　 (2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/50　 (2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/34　 (2017.01)
Ａ６１Ｋ　 9/16　 (2006.01)
Ａ６１Ｋ　45/00　 (2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/18　 (2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/24　 (2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/22　 (2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/28　 (2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/20　 (2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　 (2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/4985
Ａ６１Ｋ　 9/20
Ａ６１Ｋ　 9/48
Ａ６１Ｋ　 9/50
Ａ６１Ｋ　47/34
Ａ６１Ｋ　 9/16
Ａ６１Ｋ　45/00
Ａ６１Ｐ　25/18
Ａ６１Ｐ　25/24
Ａ６１Ｐ　25/22
Ａ６１Ｐ　25/28
Ａ６１Ｐ　25/20
Ａ６１Ｐ　43/00　　１２１

【手続補正書】
【提出日】令和3年5月26日(2021.5.26)
【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】
遊離形態または医薬上許容される塩形態の式Ｉ：

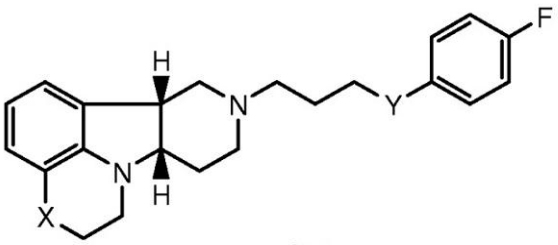
【化１】



式Ｉ

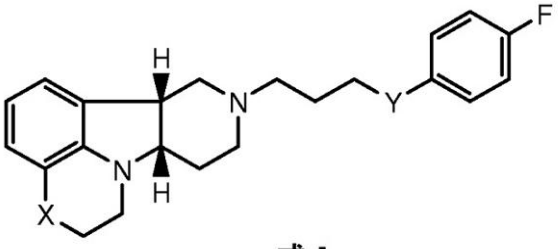
［式中、Ｘは、－Ｎ(ＣＨ$_3$)－であり；Ｙは、－Ｃ(Ｏ)－である］
で示される化合物の有効量を含む、統合失調症の陰性症状の治療を必要とする統合失調症患者における統合失調症の陰性症状の治療のための医薬組成物であって、式Ｉで示される化合物の有効量が、該化合物の対応する遊離塩基形態の重量として測定して、１日あたり４０ｍｇ～６０ｍｇである、医薬組成物。
【請求項２】
式Ｉで示される化合物が、医薬上許容される塩形態である、請求項１記載の医薬組成物。
【請求項３】
式Ｉで示される化合物が、トルエンスルホン酸付加塩形態である、請求項１または２記載の医薬組成物。
【請求項４】
式Ｉで示される化合物の有効量が、該化合物の対応する遊離塩基形態の重量として測定して、１日あたり約４０ｍｇである、請求項１～３いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項５】
該化合物がトルエンスルホン酸付加塩形態であり、式Ｉで示される化合物の有効量が、１日１回投与される該塩形態６０ｍｇ（遊離塩基約４１.７ｍｇと等価）である、請求項１～３いずれか記載の医薬組成物。
【請求項６】
陰性症状が、情動的引きこもり、受動的社会的引きこもり、無欲性社会的引きこもり、自発性の喪失、常同思考、および能動的社会的回避から選択される、請求項１～５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項７】
該医薬組成物が、統合失調症の陽性症状および陰性症状を改善する、請求項１～５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項８】
該医薬組成物が、患者の社会的統合（social integration）および社会的機能を向上させる、請求項１～５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項９】
該患者が、治療開始時に統合失調症の顕著な陰性症状を有する、請求項１～５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項１０】
該患者が、併存性不安、認知障害、および／または不眠症を有する、請求項１～５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項１１】
該患者が、別の抗精神病薬による治療後も統合失調症の陰性症状に罹患している、請求項１～５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項１２】
該患者が、以前、別の抗精神病薬での治療に対し適切に反応しなかった、請求項１～５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項１３】

遊離形態または医薬上許容される塩形態の式Ｉ：
【化２】



式Ｉ

［式中、Ｘは、－Ｎ(ＣＨ$_3$)－であり；Ｙは、－Ｃ(Ｏ)－である］
で示される化合物の有効量を含む、統合失調症の治療を必要とする患者における高プロラクチン血症、ＥＰＳ／アカシジア、体重増加または心血管系副作用を伴わない統合失調症の治療のための医薬組成物であって、式Ｉで示される化合物の有効量が、該化合物の対応する遊離塩基形態の重量として測定して、１日あたり４０ｍｇ～６０ｍｇである、医薬組成物。
【請求項１４】
式Ｉで示される化合物が、医薬上許容される塩形態である、請求項１３記載の医薬組成物。
【請求項１５】
式Ｉで示される化合物が、トルエンスルホン酸付加塩形態である、請求項１３または１４記載の医薬組成物。
【請求項１６】
式Ｉで示される化合物の有効量が、該化合物の対応する遊離塩基形態の重量として測定して、１日あたり約４０ｍｇである、請求項１３～１５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項１７】
該化合物がトルエンスルホン酸付加塩形態であり、式Ｉで示される化合物の有効量が、１日１回投与される該塩形態６０ｍｇ（遊離塩基約４１.７ｍｇと等価）である、請求項１３～１５いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項１８】
該患者が、以前、別の抗精神病薬での治療に対し適切に反応しなかった、請求項１３～１７いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項１９】
遊離形態または医薬上許容される塩形態の式Ｉ：
【化３】



式Ｉ

［式中、Ｘは、－Ｎ(ＣＨ$_3$)－であり；Ｙは、－Ｃ(Ｏ)－である］
で示される化合物の有効量を含む、統合失調症の治療を必要とする患者における統合失調症の治療のための医薬組成物であって、該患者が、併存性うつ病を有しており、該患者が、治療開始時および別の抗精神病薬による治療後に統合失調症の顕著な陰性症状を有し、式Ｉで示される化合物の有効量が、該化合物の対応する遊離塩基形態の重量として測定して、１日あたり４０ｍｇ～６０ｍｇである、医薬組成物。
【請求項２０】

式Ｉで示される化合物が、医薬上許容される塩形態である、請求項１９記載の医薬組成物。
【請求項２１】
式Ｉで示される化合物が、トルエンスルホン酸付加塩形態である、請求項１９または２０記載の医薬組成物。
【請求項２２】
式Ｉで示される化合物の有効量が、該化合物の対応する遊離塩基形態の重量として測定して、１日あたり約４０ｍｇである、請求項１９～２１いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項２３】
該化合物がトルエンスルホン酸付加塩形態であり、式Ｉで示される化合物の有効量が、１日１回投与される該塩形態６０ｍｇ（遊離塩基約４１.７ｍｇと等価）である、請求項１９～２１いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項２４】
該患者が、治療開始時に、６を超えるカルガリー統合失調症用抑うつ評価尺度（Calgary Depression Scale for Schizophrenia）（ＣＤＳＳ）スコアを有する、請求項１９～２３いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項２５】
該医薬組成物が、該患者のうつ病の症状を有意に減少させるのに有効である、請求項１９～２３いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項２６】
該患者が、併存性不安、認知障害、および／または不眠症を有する、請求項１９～２３いずれか１項記載の医薬組成物。
【請求項２７】
該医薬組成物が、該患者の不安、認知障害および／または不眠症の症状を減少させるのに有効である、請求項２６記載の医薬組成物。
【請求項２８】
該患者が、以前、別の抗精神病薬での治療に対し適切に反応しなかった、請求項１９～２３いずれか１項記載の医薬組成物。