

【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4月8日(2021.4.8)

【公表番号】特表2020-520936(P2020-520936A)

【公表日】令和2年7月16日(2020.7.16)

【年通号数】公開・登録公報2020-028

【出願番号】特願2019-563863(P2019-563863)

【国際特許分類】

C 0 7 D 207/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 207/12 C S P

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 15/00

A 6 1 K 31/40

【手続補正書】

【提出日】令和3年2月22日(2021.2.22)

【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

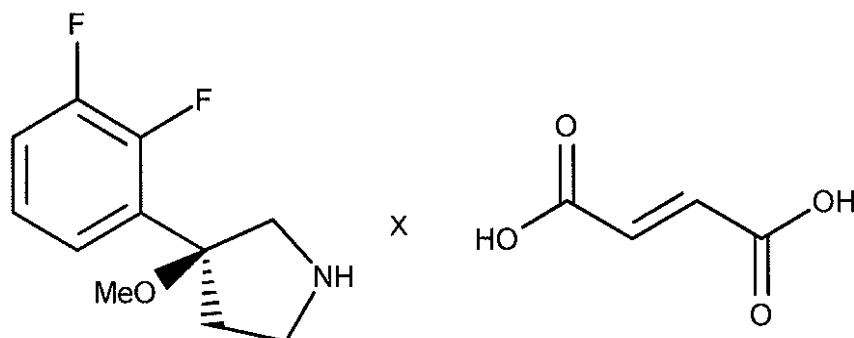
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I I b の塩：

【化 1】



式 IIb

【請求項 2】

結晶質であることによって特徴づけられる、請求項 1 に記載の式 I I b の塩。

【請求項 3】

約 6.7、約 13.4、約 23.2、約 27.8 および約 29.4 2θ にピークを含む XRPD ディフракログラムによって特徴づけられる、請求項 1 または 2 に記載の式 I I b の塩。

【請求項 4】

その重量を、任意の相対湿度のような任意の湿度で約 ± 0.2 重量% 以下変化させる、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の式 I I b の塩。

【請求項 5】

任意の相対湿度のような任意の湿度で、その結晶相を変化させない、請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の式 I I b の塩。

【請求項 6】

相対湿度のような湿度が約 0%～約 100%、または約 0%～約 97% の範囲内であり、および

相対湿度のような湿度が、約 30℃ のような約 20℃～約 50℃ の範囲内の温度で測定される、請求項 4 または 5 に記載の式 I I b の塩。

【請求項 7】

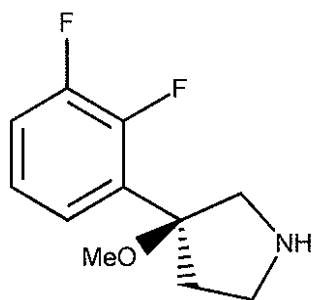
164.1℃ のような約 163℃～約 165℃ の融点を有し、および

34 mg/mL または 74.1 mg/mL のような約 30 mg/mL～約 80 mg/mL の室温での水溶性を有する、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の式 I I b の塩。

【請求項 8】

(i) フマル酸および (ii) 式 I I の化合物：

【化 2】



式 II

の組み合わせであり、

(i) および (ii) は 1 : 1 の比に規定されており、

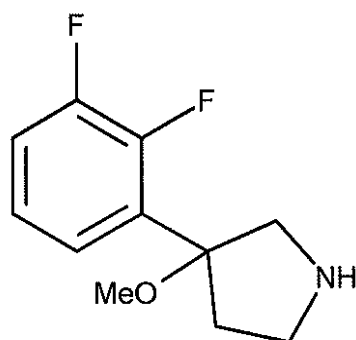
式 I I の化合物は、ジュウテリウムのような同位体で標識されている、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の式 I I b の塩。

【請求項 9】

請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の式 I I b の塩を製造するための方法であって、

— 式 I の化合物：

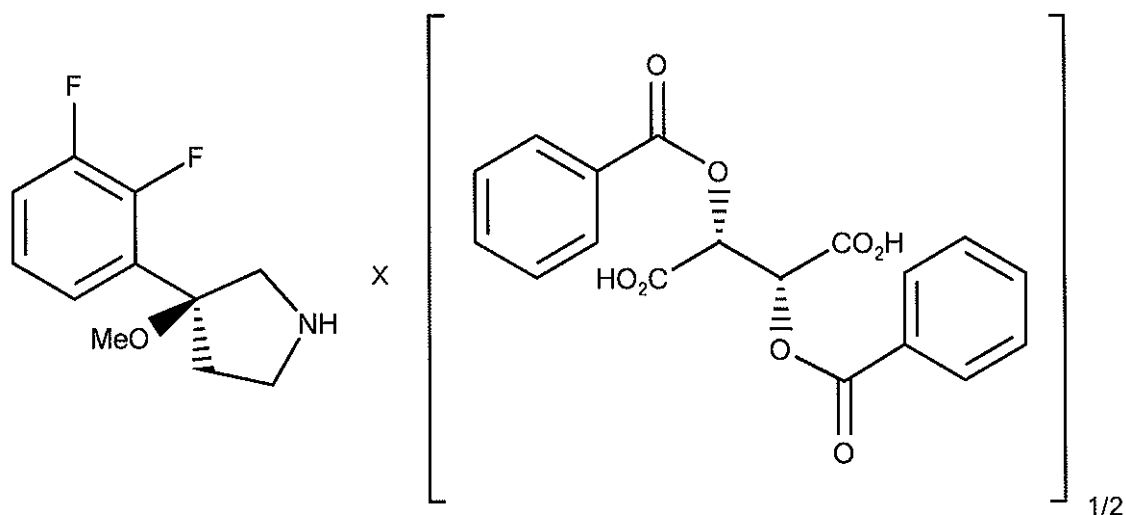
【化 3】



式 I

を、少なくとも 1 種の溶媒の存在下で前記式 I の化合物を (－)－ジベンゾイル－L－酒石酸と組み合わせることによって分割し、それによって、式 I I a の塩：

【化 4】

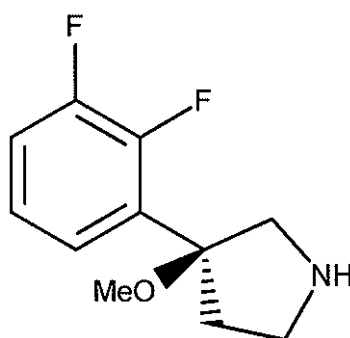


式 IIa

を得る工程と、

- 場合により、式 I I a の塩を単離および乾燥する工程と、
- (－)－ジベンゾイル－L－酒石酸を式 I I a の塩から除去し、それによって、式 I I の化合物：

【化 5】



式 II

を得る工程と、

- 式 I I の化合物をフマル酸と組み合わせ、それによって、式 I I b の塩を得る工程とを含む前記方法。

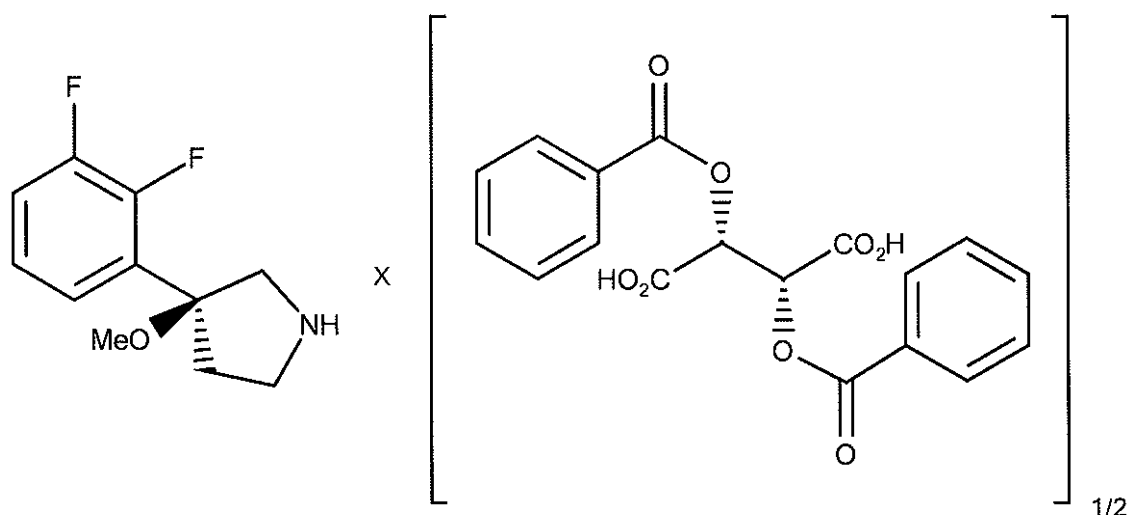
【請求項 10】

少なくとも 1 種の溶媒および／または少なくとも 1 種のさらなる溶媒は、メタノール、エタノール、1－プロパノール、2－プロパノール、1－ブタノール、2－ブタノール、およ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、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

式 I I a の塩：

【化 6】



式 IIa

【請求項 1 2】

請求項 1 ～ 1 0 のいずれか 1 項に記載の式 I I b の塩を、
薬学的に許容される賦形剤、担体および／または希釈剤との混合物で含む医薬組成物。

【請求項 1 3】

治療において薬剤として使用するための、
請求項 1 ～ 1 0 のいずれか 1 項に記載の式 I I b の塩。

【請求項 1 4】

認知症、加齢性認知障害、自閉症スペクトラム障害、A D H D、脳性麻痺、ハンチントン病、ジル・ドゥ・ラ・トゥレット症候群、うつ病、双極性障害、統合失調症、統合失調症様障害、全般性不安障害（G A D）、特定の恐怖症、パニック障害、睡眠障害、双極性障害、薬物誘導性精神病性障害、医原性精神病、医原性幻覚症、非医原性精神病、非医原性幻覚症、気分障害、不安障害、うつ病、強迫性疾患、加齢に関連する情緒障害、アルツハイマー病、パーキンソン病型認知症、認知症精神行動症状、脳損傷、物質乱用、食物の誤用によって特徴づけられる障害、性障害、摂食障害、肥満、頭痛、筋緊張の増大によって特徴づけられる状態における疼痛、運動障害、パーキンソン病、パーキンソニズム、パーキンソン症候群、運動障害、L - D O P A 誘導性運動障害、ジストニア、神経発達障害、神経変性障害、チック、振戦、レストレスレッグ、ナルコレプシー、行動障害のうちの少なくとも 1 つである疾患、障害および／または状態の処置および／または予防のための薬剤を製造するための、
請求項 1 ～ 1 0 のいずれか 1 項に記載の式 I I b の塩、または
請求項 1 1 に記載の式 I I a の塩の使用。

【請求項 1 5】

前記疾患、障害および／または状態はパーキンソン病型認知症、認知症精神行動症状である、請求項 1 4 に記載の使用。