

【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5年9月20日(2023.9.20)

【国際公開番号】WO2021/048821  
 【公表番号】特表2022-547604(P2022-547604A)  
 【公表日】令和4年11月14日(2022.11.14)  
 【年通号数】公開公報(特許)2022-209  
 【出願番号】特願2022-516271(P2022-516271)  
 【国際特許分類】

10

A 6 1 K 3 1 / 4 4 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 2 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 2 5 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 4 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【 F I 】

A 6 1 K 3 1 / 4 4 5  
 A 6 1 P 2 5 / 2 6  
 A 6 1 P 2 5 / 0 2 1 0 4  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 2 1  
 A 6 1 K 4 5 / 0 0

20

【手続補正書】  
 【提出日】令和5年9月11日(2023.9.11)  
 【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】

30

【請求項1】

過度の眠気を減少させるかまたは治療することを必要とする対象においてそれを実施するための医薬の製造における、メチル3-(メチルスルホニル)アミノ)-2-(4-フェニルシクロヘキシル)オキシ)メチル)ピペリジン-1-カルボキシレート(化合物(I))、またはその塩の使用であって、前記対象への有効量の化合物(I)またはその塩の投与後、化合物(I)の血漿濃度が約1時間以上にわたって約50.90ng/mL以上である、前記使用。

【請求項2】

前記対象のオレキシンレベルが損なわれていないか、または部分的に損なわれている、請求項1に記載の使用。

40

【請求項3】

前記対象が、過度の眠気に関連する疾患または障害または症状に苦しんでいる、請求項1に記載の使用。

【請求項4】

前記対象が、睡眠不足の対象、過度の眠気を有する対象、中断する規則的な睡眠サイクルを有する対象、または眠気を減少させる必要がある対象である、請求項1に記載の使用。

【請求項5】

前記過度の眠気がナルコレプシー2型、特発性過眠症、交代勤務障害、交代勤務睡眠障害、または時差ぼけ症候群によって引き起こされる、請求項1に記載の使用。

50

## 【請求項 6】

前記過度の眠気がナルコレプシー 2 型によって引き起こされる、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 7】

前記過度の眠気が日中の過度の眠気である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 8】

前記日中の過度の眠気が、持続的気道陽圧法 (CPAP) を使用しているにもかかわらず、閉塞性睡眠時無呼吸によって引き起こされる、請求項 7 に記載の使用。

## 【請求項 9】

化合物 (I) の血漿濃度が約 1 時間以上にわたって約  $60.54 \text{ ng/mL}$  以上である、請求項 1 に記載の使用。 10

## 【請求項 10】

化合物 (I) の血漿濃度が約 4 時間以上にわたって約  $60.54 \text{ ng/mL}$  以上である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 11】

化合物 (I) の血漿濃度が約 4 時間以上にわたって約  $150 \text{ ng/mL}$  以上である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 12】

化合物 (I) のさらなる血漿濃度が、睡眠時間の約 1 時間前に、化合物 (I) の投与の  $C_{max}$  の約半分以下である、請求項 1 に記載の使用。 20

## 【請求項 13】

化合物 (I) のさらなる血漿濃度が、睡眠時間の約 1 時間前に、化合物 (I) の投与の  $C_{max}$  の約 4 分の 1 以下である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 14】

化合物 (I) のさらなる血漿濃度が、睡眠時間の約 1 時間前に、 $50.90 \text{ ng/mL}$  の約半分以下である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 15】

化合物 (I) のさらなる血漿濃度が、睡眠時間の約 1 時間前に、 $50.90 \text{ ng/mL}$  の約 4 分の 1 以下である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 16】

化合物 (I) の投与の  $C_{max}$  が、約  $94.66 \text{ ng/mL}$  以上である、請求項 1 に記載の使用。 30

## 【請求項 17】

化合物 (I) の投与の AUC が、約  $829 \text{ ng} \cdot \text{h/mL}$  以上である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 18】

前記過度の眠気が、日中の過度の眠気または労働時間中の過度の眠気である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 19】

前記投与が、非経口投与である、請求項 1 に記載の使用。 40

## 【請求項 20】

前記非経口投与が、静脈内投与、皮下投与、経皮投与、皮内投与、または経粘膜投与である、請求項 19 に記載の使用。

## 【請求項 21】

前記投与が、単回の毎日の投与または複数の毎日の投与である、請求項 1 に記載の使用。

## 【請求項 22】

前記有効量が約  $20 \text{ mg}$  ~ 約  $500 \text{ mg}$  である、請求項 1 ~ 21 のいずれかに記載の使用。

## 【請求項 23】

50

- 前記有効量が約 30 mg ~ 約 300 mg である、請求項 2.2 に記載の使用。
- 【請求項 2.4】  
前記有効量が約 40 mg ~ 約 300 mg である、請求項 2.2 に記載の使用。
- 【請求項 2.5】  
前記有効量が約 40 mg ~ 約 200 mg である、請求項 2.2 に記載の使用。
- 【請求項 2.6】  
前記有効量が約 20 mg ~ 約 500 mg の範囲内で徐々に増加する、請求項 2.2 に記載の使用。
- 【請求項 2.7】  
前記有効量が約 40 mg ~ 約 200 mg の範囲内で徐々に増加する、請求項 2.2 に記載の使用。 10
- 【請求項 2.8】  
化合物 (I) が 1 日あたり少なくとも 1 回投与される、請求項 1 ~ 2.1 のいずれかに記載の使用。
- 【請求項 2.9】  
1 つ以上の追加の療法を投与することをさらに含む、請求項 1 ~ 2.1 のいずれかに記載の使用。
- 【請求項 3.0】  
前記 1 つ以上の追加の療法が、刺激剤、抗うつ剤、中枢神経系抑制剤、及びヒスタミン 3 (H3) 受容体アンタゴニストから選択される、請求項 2.9 に記載の使用。 20
- 【請求項 3.1】  
化合物 (I) が光学活性化合物である、請求項 1 ~ 2.1 のいずれかに記載の使用。
- 【請求項 3.2】  
化合物 (I) がメチル (2R, 3S) - 3 - ((メチルスルホニル)アミノ) - 2 - ((シス - 4 - フェニルシクロヘキシル)オキシ)メチル)ピペリジン - 1 - カルボキシレート (化合物 A) である、請求項 1 ~ 2.1 のいずれかに記載の使用。
- 【請求項 3.3】  
(a) メチル 3 - ((メチルスルホニル)アミノ) - 2 - ((4 - フェニルシクロヘキシル)オキシ)メチル)ピペリジン - 1 - カルボキシレート (化合物 (I)) またはその塩と、(b) そのための薬学的に許容される担体と、を含み、約 1 時間以上にわたって約 50.90 ng/mL 以上の化合物 (I) の血漿濃度をもたらす、医薬組成物。 30
- 【請求項 3.4】  
約 94.66 ng/mL 以上の化合物 (I) の Cmax をもたらす、請求項 3.3 に記載の医薬組成物。
- 【請求項 3.5】  
約 829 ng \* h / mL 以上の化合物 (I) の AUC をもたらす、請求項 3.3 に記載の医薬組成物。
- 【請求項 3.6】  
非経口投与用に製剤化された、請求項 3.3 に記載の医薬組成物。
- 【請求項 3.7】  
化合物 (I) が光学活性化合物である、請求項 3.3 ~ 3.6 のいずれかに記載の医薬組成物。 40
- 【請求項 3.8】  
化合物 (I) が、メチル (2R, 3S) - 3 - ((メチルスルホニル)アミノ) - 2 - ((シス - 4 - フェニルシクロヘキシル)オキシ)メチル)ピペリジン - 1 - カルボキシレート (化合物 A) である、請求項 3.3 ~ 3.6 のいずれかに記載の医薬組成物。
- 【請求項 3.9】  
前記使用が、前記対象において覚醒を高めるかまたは過度の眠気を減少させる、前記対象において覚醒維持検査 (MWT) において入眠潜時を増加させる、前記対象において客観的眠気または EEG によって測定される眠気を減少させるかまたは改善する、前記対象に 50

においてカロリンスカ眠気尺度（KSS）評価を改善する、前記対象において主観的眠気を減少させるかまたは改善する、またはそれらの組み合わせである、請求項1記載の使用。

10

20

30

40

50