

【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 1 年 11 月 21 日 (2019.11.21)

【公表番号】特表 2017-531683 (P2017-531683A)

【公表日】平成 29 年 10 月 26 日 (2017.10.26)

【年通号数】公開・登録公報 2017-041

【出願番号】特願 2017-522213 (P2017-522213)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 25/20

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/20

【誤訳訂正書】

【提出日】令和 1 年 10 月 11 日 (2019.10.11)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

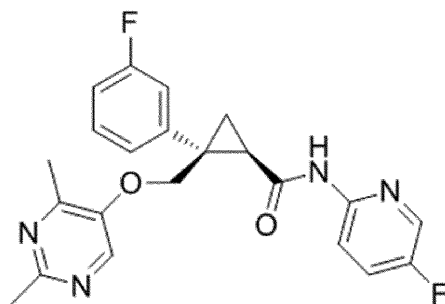
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤であって、前記治療有効量が、ヒト対象者への投与後に、化合物 A の 1 m g 当たり約 3 . 0 n g / m l ~ 約 7 . 2 n g / m l の平均 C m a x を達成する 1 日 1 回 2 . 5 m g ~ 1 0 m g の範囲 の投与量であり、前記化合物 A が、以下の式

【化 1】



によって表される (1 R , 2 S) - 2 - (((2 , 4 - ジメチルピリミジン - 5 - イル) オキシ) メチル) - 2 - (3 - フルオロフェニル) - N - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) シクロプロパンカルボキサミドである、経口製剤。

【請求項 2】

前記治療有効量が 1 日 1 回 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回 5 m g の投与量が、 2

3 ng/ml の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 Cmax を達成する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 3】

前記治療有効量が 1 日 1 回 10 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回 10 mg の投与量が、36 ng/ml の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 Cmax を達成する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 4】

前記治療有効量が、化合物 A の 1 mg 当たり約 15.9 ng*hr/ml ~ 約 23.8 ng*hr/ml の平均 AUC (0 - 24) を達成する 1 日 1 回の投与量である、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 5】

前記治療有効量が 1 日 1 回 5 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回 5 mg の投与量が、95 ng*hr/ml の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を達成する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 6】

前記治療有効量が 1 日 1 回 10 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回 10 mg の投与量が、159 ng*hr/ml の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を達成する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 7】

前記治療有効量が、化合物 A の 1 mg 当たり約 19.1 ng*hr/ml ~ 約 51.1 ng*hr/ml の平均 AUC (0 - t) を達成する 1 日 1 回の投与量である、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 8】

前記治療有効量が 1 日 1 回 5 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回 5 mg の投与量が、128 ng*hr/ml の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 9】

前記治療有効量が 1 日 1 回 10 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回 10 mg の投与量が、284 ng*hr/ml の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 10】

前記治療有効量が、化合物 A の 1 mg 当たり約 19.8 ng*hr/ml ~ 約 53.1 ng*hr/ml の平均 AUC (0 - inf) を達成する 1 日 1 回の投与量である、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 11】

前記治療有効量が 1 日 1 回 5 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回 5 mg の投与量が、149 ng*hr/ml の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - inf) を達成する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 12】

前記治療有効量が 1 日 1 回 10 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回 10 mg の投与量が、311 ng*hr/ml の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - inf) を達成する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 13】

前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への単回投与の 8 ~ 10 時間後に約 20 ng/ml 以下の平均血漿中化合物 A 濃度となる、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 14】

J P 16 の 6.10 溶出試験法または U S P 37 の < 711 > 溶出における即放性製剤についての手順に従い、装置 2 (パドル装置、パドル速度; 75 rpm) を使用する溶出試験の開始から 30 分以内に、溶媒 (0.5% ポリソルベート 80 を含有する 0.1 mol/L 塩酸、900 mL、 37 ± 0.5) 中で 85% 以上の溶出率となる、請求項 1

に記載の製剤。

【請求項 15】

J P 1 6 の 6 . 1 0 溶出試験法または U S P 3 7 の < 7 1 1 > 溶出における即放性製剤についての手順に従い、装置 2 (パドル装置、パドル速度 ; 5 0 r p m) を使用する溶出試験の開始から 1 5 分以内に、溶解媒体 (0 . 1 m o l / L 塩酸、9 0 0 m L 、 $3 7 \pm 0 . 5$) 中で 8 5 % 以上の溶出率となる、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 16】

薬剤学的に許容される賦形剤としてラクトースを含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 17】

薬剤学的に許容される賦形剤として低置換度ヒドロキシプロピルセルロースを含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 18】

薬剤学的に許容される賦形剤としてラクトースおよび低置換度ヒドロキシプロピルセルロースを含む、請求項 1 に記載の製剤。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 2】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量投与後に、化合物 A の 1 m g 当たり約 3 . 0 n g / m l ~ 約 7 . 2 n g / m l の平均最大血漿中濃度 (C m a x) となる 1 日 1 回の投与量である。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 3】

ある実施形態において、不眠症の治療方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が、約 1 m g ~ 約 1 5 m g の範囲の 1 日 1 回の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量投与後に、化合物 A の 1 m g 当たり約 3 . 0 n g / m l ~ 約 7 . 2 n g / m l の平均最大血漿中濃度 (C m a x) を達成する。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 4

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 4】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 1 m g の投与量であり、前記 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量投与後に、5 . 3 n g / m l の約 8 0 % ~ 約 1 2 5 % の範囲内の平均最大血漿中濃度 (C m a x) を達成する。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 5 】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 2 . 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量投与後に、1 6 n g / m l の約 8 0 % ~ 約 1 2 5 % の範囲内の平均最大血漿中濃度 (C m a x) を達成する。

【 誤 訳 訂 正 6 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 6

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 6 】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量投与後に、2 3 n g / m l の約 8 0 % ~ 約 1 2 5 % の範囲内の平均最大血漿中濃度 (C m a x) を実現する。

【 誤 訳 訂 正 7 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 7

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 7 】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 1 0 m g 量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量投与後に、3 6 n g / m l の約 8 0 % ~ 約 1 2 5 % の範囲内の平均最大血漿中濃度 (C m a x) を実現する。

【 誤 訳 訂 正 8 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 8 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量投与後に、化合物 A の 1 m g 当たり約 1 5 . 9 n g * h r / m l ~ 約 2 3 . 8 n g * h r / m l の平均 A U C (0 - 2 4) を達成する 1 日 1 回量である。

【 誤 訳 訂 正 9 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 9

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 9 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 1 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回の投与量の投与後に、1 7 n g * h r / m l の約 8 0 % ~ 約 1 2 5 % の範囲内の平均 A U C (0 - 2 4) を達成する。

【 誤 訳 訂 正 1 0 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 0

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 0 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 2 . 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $57 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を実現する。

【誤訳訂正 1 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 1 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $95 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を達成する。

【誤訳訂正 1 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 2 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 10 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $159 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を達成する。

【誤訳訂正 1 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 3 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、化合物 A の 1 m g 当たり約 $19.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $51.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - t) を達成する 1 日 1 回の投与量である。

【誤訳訂正 1 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 4

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 4 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 1 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $19 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する。

【誤訳訂正 1 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 5 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 2 . 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $80 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する。

【 誤訳訂正 1 6 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 6

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 6 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $128 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する。

【 誤訳訂正 1 7 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 7

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 7 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 10 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $284 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する。

【 誤訳訂正 1 8 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 8 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、化合物 A の 1 m g 当たり約 $19.8 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $53.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - i n f) を実現する 1 日 1 回量である。

【 誤訳訂正 1 9 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 2 9

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 2 9 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 1 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $20 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - i n f) を達成する。

【 誤訳訂正 2 0 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 0

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 0 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 2 . 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $80 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - i n f) を達成する。

【 誤訳訂正 2 1 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 1 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $149 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - i n f) を実現する。

【 誤訳訂正 2 2 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 2 】

さらなる実施形態では、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が 1 日 1 回 10 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $311 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - i n f) を達成する。

【 誤訳訂正 2 3 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 3 】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が、約 1 m g ~ 約 15 m g の範囲にわたる 1 日 1 回の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与の 8 ~ 10 時間後に約 $20 \text{ ng} / \text{ml}$ 以下の平均血漿中化合物 A 濃度となる。

【 誤訳訂正 2 4 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 5 】

別の実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、薬剤の 1 m g 当たり約 $3.0 \text{ ng} / \text{ml}$ ~ 約 $7.2 \text{ ng} / \text{ml}$ の平均最大血漿中濃度 (C m a x) を達成するための 1 日 1 回の投与量である。

【 誤訳訂正 2 5 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 6

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0036】

別の実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物Aおよび少なくとも1つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が1日1回1mgの投与量であり、前記1日1回の投与量が、ヒト対象者への1回量の投与後に、5.3ng/mlの約80%～約125%の範囲内の平均最大血漿中濃度(C_{max})を達成する。

【誤訳訂正26】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0037

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0037】

別の実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物Aおよび少なくとも1つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が1日1回2.5mgの投与量であり、前記1日1回の投与量が、ヒト対象者への1回量の投与後に、16ng/mlの約80%～約125%の範囲内の平均最大血漿濃度(C_{max})を達成する。

【誤訳訂正27】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0038

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0038】

別の実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物Aおよび少なくとも1つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が1日1回5mgの投与量であり、前記1日1回の投与量が、ヒト対象者への1回量の投与後に、23ng/mlの約80%～約125%の範囲内の平均最大血漿中濃度(C_{max})を達成する。

【誤訳訂正28】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0039

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0039】

別の実施形態では、本発明は、治療上有効量の化合物Aおよび少なくとも1つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が1日1回10mgの投与量であり、前記1日1回の投与量が、ヒト対象者への1回量の投与後に、36ng/mlの約80%～約125%の範囲内の平均最大血漿濃度(C_{max})を達成する。

【誤訳訂正29】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0040

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0040】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物Aおよび少なくとも1つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が、ヒト対象者への1回量の投与後に、薬剤の1mg当たり約15.9ng*hr/ml～約23.8ng*hr/mlの平均AUC(0-24)となる1日1回の投与量で

ある。

【誤訳訂正 3 0】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 4 1】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 1 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $17 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を達成する。

【誤訳訂正 3 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 4 2】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 2 . 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $57 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を達成する。

【誤訳訂正 3 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 4 3】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 5 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $95 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を達成する。

【誤訳訂正 3 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 4

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 4 4】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 10 m g の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $159 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - 24) を達成する。

【誤訳訂正 3 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 4 5 】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、薬剤の 1 mg 当たり約 $19.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $51.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - t) をもたらす 1 日 1 回の投与量である。

【 誤 訳 訂 正 3 5 】

【 訂 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 訂 正 対 象 項 目 名 】 0 0 4 6

【 訂 正 方 法 】 変 更

【 訂 正 の 内 容 】

【 0 0 4 6 】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 1 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $19 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する。

【 誤 訳 訂 正 3 6 】

【 訂 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 訂 正 対 象 項 目 名 】 0 0 4 7

【 訂 正 方 法 】 変 更

【 訂 正 の 内 容 】

【 0 0 4 7 】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 2.5 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $80 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する。

【 誤 訳 訂 正 3 7 】

【 訂 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 訂 正 対 象 項 目 名 】 0 0 4 8

【 訂 正 方 法 】 変 更

【 訂 正 の 内 容 】

【 0 0 4 8 】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 5 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $128 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する。

【 誤 訳 訂 正 3 8 】

【 訂 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 訂 正 対 象 項 目 名 】 0 0 4 9

【 訂 正 方 法 】 変 更

【 訂 正 の 内 容 】

【 0 0 4 9 】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 10 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $284 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) を達成する。

【誤訳訂正 39】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0050

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0050】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、薬剤の 1 mg 当たり約 $19.8 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $53.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - inf) となる 1 日 1 回の投与量である。

【誤訳訂正 40】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0051

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0051】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 1 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $20 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - inf) を達成する。

【誤訳訂正 41】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0052

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0052】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 2.5 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $80 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - inf) を達成する。

【誤訳訂正 42】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0053

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0053】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 5 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $149 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - inf) を達成する。

【誤訳訂正 43】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0054

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0054】

さらなる実施形態では、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が 1 日 1 回 10 mg の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与後に、 $311 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の約 80% ~ 約 125% の範囲内の平均 AUC (0 - inf) を達成する。

【誤訳訂正 44】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0055

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0055】

ある実施形態において、本発明は、治療有効量の化合物 A および少なくとも 1 つの薬剤学的に許容される賦形剤を含む、不眠症を治療するための経口製剤を提供し、前記治療有効量が、約 1 mg ~ 約 15 mg の範囲にわたる 1 日 1 回の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与の 8 ~ 10 時間後に約 $20 \text{ ng} / \text{ml}$ 以下の平均血漿中化合物 A 濃度となる。

(0 - inf) を達成する。

【誤訳訂正 45】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0064

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0064】

用語「有効量」は、その必要性のあるヒト対象者において治療効果を達成することができる化合物 A の薬剤量を意味する。

【誤訳訂正 46】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0066

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0066】

用語「ヒト対象者」は、正常で健康な男性もしくは女性のボランティア、および / または、不眠症又は不眠症を引き起こす任意の疾患もしくは障害の臨床上の徴候および症状を示す任意の個人を意味するものとする。

【誤訳訂正 47】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0073

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0073】

語句「残存眠気」は、通常前夜の催眠剤の投与後の翌朝に、起床に際して患者が眠気または覚醒中鎮静を感じることを指す。「翌日の障害」は、運転を含む注意力を必要とする活動を害する患者の行動を指し、これは、翌朝に覚醒しているが、血液中の催眠剤のレベルが十分に高いままである場合に起こる。カロリンスカ眠気尺度 (KSS) は、自覚的な眠気を評価するために使用される、多くのツールのうちの 1 つである。KSS は、もともと、眠気の次元尺度を構成するように開発されたものであり、アルファおよびシータ脳波 (EEG) 活動ならびに緩徐眼球運動電気眼振 (EOG) 活動に対して検証された (kerstedt and Gillberg, 1990)。残存眠気または翌日の障害の影響を評価するための他の自覚的試験は、エプワース眠気尺度 (ESS)、スタンフォード眠気尺度 (SSS)、および睡眠 - 覚醒活性目録 (SWAI) が含まれる。それらの

効果はまた、患者の記憶、患者の注意、情報処理、および精神運動機能を調査するための、当業者によるヒト対象者に対する多くの試験のうちの1つ以上を使用して評価することもでき、たとえば、数数字符号置換検査(DSST)、精神運動覚醒検査(PVT)、選択反応時間検査(CRT)、睡眠潜時検査(SLT)、視覚アナログ検査(Visual Analog Test)(VAT)、符号コピー検査(Symbol Copying Test)(SCT)、臨界フリッカー融合閾値検査(Critical Flicker Fusion threshold test)(CFF)、単純反応時間検査(視覚または聴覚; SRT)、言語学習検査(Word Learning Test)(WLT)、臨界トラッキング検査(Critical Tracking Test)(CTT)、注意分割検査(Divided Attention Test)(DAT)、数字または文字末梢検査(digit or letter cancellation test)、睡眠ポリグラフ(PSG)測定による睡眠判定、持続的遂行能検査(CPT)、多発性睡眠潜時検査(MSLT)、迅速視覚情報処理検査(RVIP)、および他を含む。

【誤訳訂正48】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0082

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0082】

1日1回1mg量の化合物Aがヒト対象者に投与されたときに、約5.3ng/mlの平均最大血漿中濃度(C_{max})；約17.2ng*hr/mlの平均AUC(0-24)；約19.1ng*hr/mlの平均AUC(0-t)；約19.8ng*hr/mlの平均AUC(0-inf)；約12.7時間の平均t_{1/2}；および約1時間の最大血漿中濃度到達平均時間(t_{max})が達成される。

【誤訳訂正49】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0083

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0083】

1日1回2.5mg量の化合物Aがヒト対象者に投与されたときに、約10ng/ml～約18ng/mlの平均最大血漿中濃度(C_{max})；約57ng*hr/ml～約60ng*hr/mlの平均AUC(0-24)；約80ng*hr/ml～約95ng*hr/mlの平均AUC(0-t)；約80ng*hr/ml～約103ng*hr/mlの平均AUC(0-inf)；約30～約37時間の平均t_{1/2}；および約1～2時間の最大血漿中濃度到達平均時間(t_{max})が達成される。

【誤訳訂正50】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0084

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0084】

1日1回5mg量の化合物Aがヒト対象者に投与されたときに、約19ng/ml～約23ng/mlの平均最大血漿中濃度(C_{max})；約95ng*hr/ml～約110ng*hr/mlの平均AUC(0-24)；約128ng*hr/mlの平均AUC(0-t)；約150ng*hr/mlの平均AUC(0-inf)；約31時間の平均t_{1/2}；および約1～約2の最大血漿中濃度到達平均時間(t_{max})が達成される。

【誤訳訂正51】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0085

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0085】

1日1回10mg量の化合物Aがヒト対象者に投与されたときに、約30ng/ml～約58ng/mlの平均最大血漿中濃度(Cmax)；約160ng*hr/ml～約190ng*hr/mlの平均AUC(0-24)；約280ng*hr/ml～約510ng*hr/mlの平均AUC(0-t)；約310ng*hr/ml～約530ng*hr/mlの平均AUC(0-inf)；約56～約60時間の平均t1/2；および約1～約3.25時間の最大血漿中濃度到達平均時間(tmax)が達成される。

【誤訳訂正52】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0086

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0086】

ある実施形態において、化合物Aの1日1回1mg量がヒト対象者に投与されたときに、(1)5.3ng/mlの約80%～約125%の範囲内の平均最大血漿中濃度(Cmax)；(2)17ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-24)；(3)19ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-t)；(4)19ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-inf)；および/または(5)1.0時間の約80%～約125%の範囲内の最大血漿中濃度到達平均時間(tmax)が達成される。

【誤訳訂正53】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0087

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0087】

別の実施形態では、化合物Aの1日1回2.5mg量がヒト対象者に投与されたときに、(1)16ng/mlの約80%～約125%の範囲内の平均最大血漿中濃度(Cmax)；(2)57ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-24)；(3)80ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-t)；(4)80ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-inf)；および/または(5)1.0時間の約80%～約125%の範囲内の最大血漿中濃度到達平均時間(tmax)が達成される。

【誤訳訂正54】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0088

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0088】

別の実施形態では、化合物Aの1日1回5mg量がヒト対象者に投与されたときに、(1)23ng/mlの約80%～約125%の範囲内の平均最大血漿中濃度(Cmax)；(2)95ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-24)；(3)128ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-t)；(4)149ng*hr/mlの約80%～約125%の範囲内の平均AUC(0-inf)；および/または(5)1.6時間の約80%～約125%の範囲内の最大血漿中濃度到達平均時間(tmax)が達成される。

【誤訳訂正55】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0089

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0089】

別の実施形態では、化合物 A の 1 日 1 回 10 mg 量がヒト対象者に投与されたときに、(1) 36 ng / ml の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均最大血漿中濃度 (C max) ; (2) 159 ng * hr / ml の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - 24) ; (3) 284 ng * hr / ml の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - t) ; (4) 311 ng * hr / ml の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の平均 AUC (0 - inf) ; および / または (5) 1 . 0 時間の約 80 % ~ 約 125 % の範囲内の最大血漿中濃度到達平均時間 (t max) が達成される。

【誤訳訂正 56】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0093

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0093】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量の投与の 8 ~ 10 時間後に約 20 ng / ml 以下の平均血漿中化合物 A 濃度をもたらす 1 日 1 回の投与量である。

【誤訳訂正 57】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0094

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0094】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量の投与の 8 ~ 10 時間後に約 18 ng / ml 以下の平均血漿化合物 A 濃度をもたらす 1 日 1 回の投与量である。

【誤訳訂正 58】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0095

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0095】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量投与の 8 ~ 10 時間後に約 15 ng / ml 以下の平均血漿中化合物 A 濃度をもたらす 1 日 1 回の投与量である。

【誤訳訂正 59】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0096

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0096】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回

量投与の 8 ～ 10 時間後に約 9.0 ng/ml 以下の平均血漿化合物 A 濃度をもたらす 1 日 1 回の投与量である。

【誤訳訂正 60】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0097

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0097】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が、ヒト対象者への 1 回量投与の 8 ～ 10 時間後に約 0.4 ng/ml ～ 約 9.0 ng/ml の平均血漿化合物 A 濃度を達成する 1 日 1 回の投与量である。

【誤訳訂正 61】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0098

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0098】

ある実施形態において、不眠症を治療する方法を提供する本発明は、治療有効量の化合物 A を有する製剤を経口で投与することを含み、前記治療有効量が、約 2.5 mg ～ 約 10 mg の範囲の 1 日 1 回の投与量であり、前記 1 日 1 回の投与量が、ヒト対象者への 1 回量の投与から 8 時間で約 1.8 ng/ml ～ 約 9.0 ng/ml または 9 時間で約 1.5 ng/ml ～ 約 5.0 ng/ml または 10 時間で約 2.0 ng/ml ～ 約 8.0 ng/ml の平均血漿中化合物 A 濃度を達成する。

【誤訳訂正 62】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0100

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0100】

本発明の製剤が、ヒト対象者への 1 回量投与後に 1) 約 3.0 ng/ml ～ 約 108 ng/ml の平均最大血漿中濃度 (Cmax) ; 2) 約 15.9 ng*hr/ml ～ 約 356.4 ng*hr/ml の平均 AUC (0 - 24) ; 3) 約 12.7 ～ 約 60 時間の平均 t1/2 ; および 4) 約 1 ～ 約 3.25 時間の最大血漿中濃度到達平均時間 (tmax) を達成する。

【誤訳訂正 63】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0101

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0101】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への 1 回量投与後、化合物 A の 1 mg 毎に約 3.0 ng/ml ～ 約 7.2 ng/ml の平均最大血漿中濃度 (Cmax) となる。

【誤訳訂正 64】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0102

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0102】

ある実施形態において、前記製剤が1 mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約5.3 ng/mlの平均最大血漿中濃度(C_{max})となる。

【誤訳訂正65】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0103

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0103】

ある実施形態において、前記製剤が2.5 mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約10 ng/ml～約18 ng/mlの平均最大血漿中濃度(C_{max})となる。

【誤訳訂正66】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0104

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0104】

ある実施形態において、前記製剤が5 mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約19 ng/ml～約23 ng/mlの平均最大血漿中濃度(C_{max})となる。

【誤訳訂正67】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0105

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0105】

ある実施形態において、前記製剤が10 mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約30 ng/ml～約58 ng/mlの平均最大血漿中濃度(C_{max})となる。

【誤訳訂正68】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0106

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0106】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への1回量投与後化合物Aの1 mg毎に約15.9 ng*hr/ml～約23.8 ng*hr/mlの平均AUC(0-24)となる。

【誤訳訂正69】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0107

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0107】

ある実施形態において、前記製剤が1 mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約17 ng*hr/mlの平均AUC(0-24)となる。

【誤訳訂正70】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0108

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 1 0 8 】

ある実施形態において、前記製剤が 2 . 5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量の投与後に約 $57 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $60 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - 24) となる。

【 誤訳訂正 7 1 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 0 9

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 1 0 9 】

ある実施形態において、前記製剤が 5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 $95 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $110 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - 24) となる。

【 誤訳訂正 7 2 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 1 0

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 0 】

ある実施形態において、前記製剤が 10 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 $160 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $190 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - 24) となる。

【 誤訳訂正 7 3 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 1 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 1 】

さらなる実施形態では、前記製剤が、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 $19.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $766.5 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - t) となる。

【 誤訳訂正 7 4 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 1 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 2 】

さらなる実施形態では、前記製剤が 1 m g ~ 15 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 $19.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $766.5 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - t) となる。

【 誤訳訂正 7 5 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 1 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 3 】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への 1 回量投与後化合物 A の 1 m g 毎に約 $19.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ~ 約 $51.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均 AUC (0 - t) となる。

【 誤訳訂正 7 6 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】 0 1 1 4

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 4 】

ある実施形態において、前記製剤が 1 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 1 9 n g * h r / m l の平均 A U C (0 - t) となる。

【誤訳訂正 7 7 】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 1 1 5

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 5 】

ある実施形態において、前記製剤が 2 . 5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 8 0 n g * h r / m l ~ 約 9 5 n g * h r / m l の平均 A U C (0 - t) となる。

【誤訳訂正 7 8 】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 1 1 6

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 6 】

ある実施形態において、前記製剤が 5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 1 2 8 n g * h r / m l の平均 A U C (0 - t) となる。

【誤訳訂正 7 9 】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 1 1 7

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 7 】

ある実施形態において、前記製剤が 1 0 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 2 8 0 n g * h r / m l ~ 約 5 1 0 n g * h r / m l の平均 A U C (0 - t) となる。

【誤訳訂正 8 0 】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 1 1 8

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 8 】

さらなる実施形態では、前記製剤が、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 1 9 . 8 n g * h r / m l ~ 約 7 9 6 . 5 n g * h r / m l の平均 A U C (0 - i n f) となる。

【誤訳訂正 8 1 】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 1 1 9

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 1 9 】

ある実施形態において、前記製剤が約 1 m g ~ 約 1 5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 1 9 . 8 n g * h r / m l ~ 約 7 9 6 . 5 n g * h r / m l の平均 A U C (0 - i n f) となる。

【誤訳訂正 8 2 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0120

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0120】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への1回量投与後化合物Aの1mg毎に約 $19.8 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ～約 $53.1 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均AUC(0-inf)となる。

【誤訳訂正83】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0121

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0121】

ある実施形態において、前記製剤が1mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約 $19.8 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均AUC(0-inf)となる。

【誤訳訂正84】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0122

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0122】

ある実施形態において、前記製剤が2.5mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約 $80 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ～約 $103 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均AUC(0-inf)となる。

【誤訳訂正85】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0123

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0123】

ある実施形態において、前記製剤が5mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約 $150 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均AUC(0-inf)となる。

【誤訳訂正86】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0124

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0124】

ある実施形態において、前記製剤が10mgの化合物Aを含み、ヒト対象者への1回量投与後に約 $310 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ ～約 $530 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{ml}$ の平均AUC(0-inf)となる。

【誤訳訂正87】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0125

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0125】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への1回量投与の8～10時間後に約 $20 \text{ ng} / \text{ml}$ 以下の平均血漿化合物A濃度となる。

【誤訳訂正 88】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0126

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0126】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への1回量投与の8～10時間後に約18 ng/ml以下の平均血漿化合物A濃度となる。

【誤訳訂正 89】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0127

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0127】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への1回量投与の8～10時間後に約15 ng/ml以下の平均血漿化合物A濃度となる。

【誤訳訂正 90】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0128

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0128】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への1回量投与の8～10時間後に約9.0 ng/ml以下の平均血漿化合物A濃度となる。

【誤訳訂正 91】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0129

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0129】

ある実施形態において、前記製剤が、ヒト対象者への1回量投与の8～10時間後に約0.4 ng/ml～約9.0 ng/mlの平均血漿化合物A濃度となる。

【誤訳訂正 92】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0130

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0130】

さらなる実施形態では、前記製剤が治療有効量の化合物Aおよび少なくとも1つの薬剤学的に許容されるキャリアまたは賦形剤を含み、前記治療有効量が、約2.5 mg～約10 mgの範囲の1日1回の投与量であり、前記1回の投与量が、ヒト対象者への1回量投与から8時間で約1.8 ng/ml～約9.0 ng/mlまたは9時間で約1.5 ng/ml～約5.0 ng/mlまたは10時間で約2.0 ng/ml～約8.0 ng/mlの平均血漿中化合物A濃度を達成する。

【誤訳訂正 93】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0131

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0131】

ある実施形態において、前記製剤が 1 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 12.7 時間の排出半減期 ($t_{1/2}$) となる。

【誤訳訂正 94】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0132

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0132】

ある実施形態において、前記製剤が 2.5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 30 ~ 37 時間の排出半減期 ($t_{1/2}$) となる。

【誤訳訂正 95】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0133

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0133】

ある実施形態において、前記製剤が 5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 31 時間の排出半減期 ($t_{1/2}$) となる。

【誤訳訂正 96】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0134

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0134】

ある実施形態において、前記製剤が 10 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 56 ~ 60 時間の排出半減期 ($t_{1/2}$) となる。

【誤訳訂正 97】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0135

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0135】

ある実施形態において、前記製剤が 1 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 1 時間の最大血漿濃度到達平均時間 (t_{max}) となる。

【誤訳訂正 98】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0136

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0136】

ある実施形態において、前記製剤が 2.5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 1 ~ 約 2 時間の最大血漿濃度到達平均時間 (t_{max}) となる。

【誤訳訂正 99】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0137

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0137】

ある実施形態において、前記製剤が 5 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 1 ~ 約 2 時間の最大血漿濃度到達平均時間 (t_{max}) となる。

【誤訳訂正 1 0 0】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 3 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 3 8】

ある実施形態において、前記製剤が 1 0 m g の化合物 A を含み、ヒト対象者への 1 回量投与後に約 1 ～ 約 3 . 2 5 時間の最大血漿濃度到達平均時間 (t m a x) となる。