

【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】平成27年4月9日 (2015.4.9)

【公表番号】特表2013-543004(P2013-543004A)

【公表日】平成25年11月28日 (2013.11.28)

【年通号数】公開・登録公報2013-064

【出願番号】特願2013-540032(P2013-540032)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/568	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 K	31/585	(2006.01)
A 6 1 K	31/569	(2006.01)
A 6 1 K	31/5685	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/568	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	3/02	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 K	31/585	
A 6 1 K	31/569	
A 6 1 K	31/5685	

【手続補正書】

【提出日】平成27年2月16日 (2015.2.16)

【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】

テストステロン欠乏症状を有するヒト対象における、慢性炎症性疼痛を軽減するための、疼痛を軽減する量のテストステロンを含む組成物であって、ここで、対象は、適切な基準範囲の下半分のテストステロンレベルを有し、疼痛は、安全かつ効果的に軽減される、前記組成物。

【請求項 2】

対象のテストステロン血清レベルを、ベースラインから適切な基準範囲の中間または上部範囲に回復させるが、基準範囲の上限を顕著に超えず、有害な臨床的副作用がない、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

慢性疼痛および解決不能なストレッサー状態に起因する疼痛からなる群から選択される状態を患っている対象における慢性炎症性疼痛を軽減するための、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

解決不能なストレッサー状態が、心的外傷後ストレス障害（PTSD）、事故、外傷、手術、自己免疫疾患、慢性未解決または急性のウイルス感染、感染症、癌、慢性疲労または物理的ディストレス、神経障害、痛覚過敏、アロディニア、悲嘆、感情的ディストレス、うつ病、気分変調、外科的生殖腺除去、薬理学的に誘発される生殖腺除去、DSM - IV 障害 307.80 および DSM - IV 障害 307.89 からなる群から選択される、請求項 3 に記載の組成物

【請求項 5】

組成物が、三環系抗うつ薬、セロトニン・ノルエピネフリン再取込み阻害剤（SNRI）および選択的セロトニン再取込み阻害剤（SSRI）からなる群から選択される抗うつ薬と組み合わせて投与される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

組成物が、約 1.0 mg ~ 約 12.8 mg のテストステロンの 1 日単位用量を女性のヒト対象に送達するために製剤化され、ここでこの投与により、遊離テストステロン血清レベルまたは 24 時間遊離テストステロン AUC が治療効果および安全性のために必要なレベルを超えて上昇することなく、定常状態の総テストステロン血清レベルがもたらされ、ここで投与が、経皮投与、経口投与、非経口投与、筋肉内投与、および口腔投与からなる群から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

組成物が経皮投与用ゲルとして製剤化され、ここでゲルは、テストステロンおよび薬学的に許容し得る担体を含む、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

テストステロンの 1 日単位用量が、定常状態の総テストステロン血清レベルを、約 0.9 ng / mL ~ 約 1.4 ng / mL の範囲内に投与後少なくとも 24 時間維持するように選択される、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 9】

遊離テストステロン血清レベルが、約 1.00 pg / mL ~ 約 3.30 pg / mL に上昇し、24 時間遊離テストステロン AUC レベルが、約 40 pg · h / mL ~ 約 65 pg · h / mL に上昇する、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 10】

組成物テストステロンが、約 35 mg ~ 約 100 mg のテストステロンの 1 日単位用量を男性のヒト対象に送達するために投与され、ここでこの投与により、遊離テストステロン血清レベルまたは 24 時間遊離テストステロン AUC が治療効果および安全性のために必要なレベルを超えて上昇することなく、定常状態の総テストステロン血清レベルがもた

らされ、ここで投与が、経皮投与、経口投与、非経口投与、筋肉内投与、および口腔投与からなる群から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 1】

テストステロンの 1 日単位用量が、定常状態の総テストステロン血清レベルを、約 2 . 4 n g / m L ~ 約 9 . 5 n g / m L の範囲内に投与後少なくとも 2 4 時間維持するように選択される、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

遊離テストステロン血清レベルが、約 9 0 p g / m L ~ 約 3 0 0 p g / m L に上昇し、2 4 時間遊離テストステロン A U C レベルが、約 3 5 0 p g - h / m L ~ 約 8 0 0 p g - h / m L に上昇する、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 3】

組成物が、テストステロンおよび少なくとも 1 種の薬学的に許容し得る担体から本質的になる、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

ヒト対象が、低い内因性オピオイドペプチドレベルを有し、組成物が、ヒト対象の内因性オピオイドペプチド産生を増加させる、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

オピオイドペプチドが、エンケファリン、エンドルフィン、ダイノルフィン、アドレノルフィン、アミドルフィン、およびオビオルフィンからなる群から選択される、請求項 1 4 に記載の組成物。

【請求項 1 6】

内因性オピオイドペプチドレベルが、脳脊髄液において測定される、請求項 1 4 に記載の組成物。

【請求項 1 7】

テストステロン欠乏のヒト対象の痛覚閾値を高めるために用いられる、痛覚閾値を高める量のテストステロンを含む組成物であって、ヒト対象が、適切な基準範囲の下半分のテストステロンレベルを有し、ヒト対象の痛覚閾値は、高められる、前記組成物。

【請求項 1 8】

対象のテストステロン血清レベルを、ベースラインから適切な基準範囲の中間または上部範囲に回復させるが、基準範囲の上限を顕著に超えず、有害な臨床的副作用がない、請求項 1 7 に記載の組成物。

【請求項 1 9】

C 反応性タンパク質の上昇、赤血球沈降速度の上昇または解決不能なストレッサー状態から選択される少なくとも 1 つのアンドロゲン欠乏症を患う対象の痛覚閾値を高めるための、請求項 1 7 に記載の組成物。

【請求項 2 0】

対象が、心的外傷後ストレス障害 (P T S D)、事故、外傷、手術、自己免疫疾患、慢性未解決または急性のウイルス感染、感染症、癌、慢性疲労または物理的ディストレス、神経障害、痛覚過敏、アロディニア、悲嘆、感情的ディストレス、うつ病、気分変調、外科的生殖腺除去、および薬理学的に誘発される生殖腺除去、D S M - I V 障害 3 0 7 . 8 0 および D S M - I V 障害 3 0 7 . 8 9 からなる群から選択される解決不能なストレッサー状態を患っている、請求項 1 7 に記載の組成物。

【請求項 2 1】

組成物が、三環系抗うつ薬、セロトニン・ノルエピネフリン再取込み阻害剤 (S N R I) および選択的セロトニン再取込み阻害剤 (S S R I) からなる群から選択される抗うつ薬と組み合わせて投与される、請求項 1 7 に記載の組成物。

【請求項 2 2】

組成物が、約 1 . 0 m g ~ 約 1 2 . 8 m g のテストステロンの 1 日単位用量を女性のヒト対象に送達するために投与され、ここでこの投与により、遊離テストステロン血清レベルまたは 2 4 時間遊離テストステロン A U C が治療効果および安全性のために必要なレベ

ルを超えて上昇することなく、定常状態の総テストステロン血清レベルがもたらされ、ここで投与が、経皮投与、経口投与、非経口投与、筋肉内投与、および口腔投与からなる群から選択される、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 23】

組成物が経皮投与用ゲルとして製剤化され、ここでゲルは、テストステロンおよび少なくとも 1 種の薬学的に許容し得る担体を含む、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 24】

テストステロンの 1 日単位用量が、定常状態の総テストステロン血清レベルを、約 0.9 ng/mL ~ 約 1.4 ng/mL の範囲内に投与後少なくとも 24 時間維持するように選択される、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 25】

遊離テストステロン血清レベルが、約 1.00 pg/mL ~ 約 3.30 pg/mL に上昇し、24 時間遊離テストステロン AUC レベルが、約 40 pg · h/mL ~ 約 65 pg · h/mL に上昇する、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 26】

組成物が、約 35 mg ~ 約 100 mg のテストステロンの 1 日単位用量を男性のヒト対象に送達するために投与され、ここでこの投与により、遊離テストステロン血清レベルまたは 24 時間遊離テストステロン AUC が治療効果および安全性のために必要なレベルを超えて上昇することなく、定常状態の総テストステロン血清レベルがもたらされ、ここで投与が、経皮投与、経口投与、非経口投与、筋肉内投与、および口腔投与からなる群から選択される、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 27】

テストステロンの 1 日単位用量が、定常状態の総テストステロン血清レベルを、約 2.4 ng/mL ~ 約 9.5 ng/mL の範囲内に投与後少なくとも 24 時間維持するように選択される、請求項 26 に記載の組成物。

【請求項 28】

遊離テストステロン血清レベルが、約 90 pg/mL ~ 約 300 pg/mL に上昇し、24 時間遊離テストステロン AUC レベルが、約 350 pg · h/mL ~ 約 800 pg · h/mL に上昇する、請求項 26 に記載の組成物。

【請求項 29】

組成物が、テストステロンおよび少なくとも 1 種の薬学的に許容し得る担体から本質的になる、請求項 17 に記載の組成物。