

【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12月9日(2021.12.9)

【公開番号】特開2021-152077(P2021-152077A)

【公開日】令和3年9月30日(2021.9.30)

【年通号数】公開・登録公報2021-047

【出願番号】特願2021-110038(P2021-110038)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/341 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/341

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和3年11月1日(2021.11.1)

【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】

レセプタータイプ1細胞として細胞を分類することにおいて、

【化1A】

⊖

テトラヒドロ-N,N-ジメチル-2,2-ジフェニル-3-フランメタンアミンヒドロ

クロリド(

【化1B】

⊖ A2-73

)を使用する方法であって、

(i)前記細胞を、既知の レセプター結合リガンドに十分に結合させることと;

(ii)前記細胞に結合した前記既知の レセプター結合リガンドの量を測定し、したがって、コントロール特異的結合を得ることと;

(iii)前記十分に結合した細胞を、検出可能な量の

【化1C】

⊖ A2-73

を含み、

【化2A】

⊕

テトラヒドロ-N,N-ジメチル-2,2-ジフェニル-3-フランメタンアミンヒドロ

クロリド(

【化2B】

⊕ A2-73

)を実質的に含まない組成物に曝すことと;

(i v) 前記検出可能な量の

【化1D】

⊖ A2-73

の存在下で前記細胞になお結合している前記既知の レセプター結合リガンドの量を測定し、したがって、阻害性結合を得ることと;

(v) 前記コントロール特異的結合と前記阻害性結合の間の差に基づいて、阻害性結合率を計算することと;

(vi) 前記計算した阻害性結合率が 50 % 以上の場合、前記細胞を レセプタータイプ1として分類することと

を含む、方法。

【請求項2】

前記既知の レセプター結合リガンドが (+) - ペンタゾシンまたは (+) - SKF - 10,047 を含む、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

前記組成物が

【化2C】

⊕ A2-73

を実質的に含まず、

【化1E】

⊖ A2-73

に関して 2 % (w/w) 未満を構成する、請求項1に記載の方法。

【請求項4】

【化1F】

⊖ A2-73

の前記検出可能な量が、0.5 mg ~ 100 mg を含む、請求項1に記載の方法。

【請求項5】

【化1G】

⊖ A2-73

の前記検出可能な量が、1 ~ 20 mg を含む、請求項1に記載の方法。

【請求項6】

必要とする被験体において 1 レセプターの刺激を増強するための医薬の製造における、エナンチオマー (-) テトラヒドロ-N,N-ジメチル-2,2-ジフェニル-3-フランメタンアミンヒドロクロリド ((-) A2-73) の使用。

【請求項7】

前記医薬が

【化2D】

⊕

テトラヒドロ-N,N-ジメチル-2,2-ジフェニル-3-フランメタンアミンヒドロクロリド (

【化2E】

⊕ A2-73

) のエナンチオマーを実質的に含まない、請求項6に記載の使用。

【請求項8】

前記医薬が

【化2F】

⊕ A2-73

を実質的に含まず、

【化1H】

⊖ A2-73

に関して2% (w/w) 未満を構成する、請求項7に記載の使用。

【請求項9】

前記医薬が0.5~100mgの(-)A2-73を含む、請求項6に記載の使用。

【請求項10】

前記医薬が1~20mgの(-)A2-73を含む、請求項6に記載の使用。

【請求項11】

前記1レセプターの刺激の増強が、アルツハイマー病、認知症、脳卒中、虚血、酸化的ストレス、神経毒性、またはこれらの組み合わせを含む疾患および障害に対する神経保護効果を誘発する、請求項6に記載の使用。

【請求項12】

必要とする被験体において1レセプターの刺激を増強するための、エナンチオマー(-)テトラヒドロ-N,N-ジメチル-2,2-ジフェニル-3-フランメタンアミンヒドロクロリド((-)A2-73)を含む組成物。

【請求項13】

【化2G】

⊕

テトラヒドロ-N,N-ジメチル-2,2-ジフェニル-3-フランメタンアミンヒドロクロリド(

【化2H】

⊕ A2-73

) のエナンチオマーを実質的に含まない、請求項12に記載の組成物。

【請求項14】

【化2I】

⊕ A2-73

を実質的に含まず、

【化1I】

⊖ A2-73

に関して2% (w/w) 未満を構成する、請求項13に記載の組成物。

【請求項15】

0.5~100mgの(-)A2-73を含む、請求項12に記載の組成物。

【請求項16】

1~20mgの(-)A2-73を含む、請求項12に記載の組成物。

【請求項17】

前記 1 レセプターの刺激の増強が、アルツハイマー病、認知症、脳卒中、虚血、酸化的ストレス、神経毒性、またはこれらの組み合わせを含む疾患および障害に対する神経保護効果を誘発する、請求項 1 2 に記載の組成物。