

【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4年8月2日(2022.8.2)

【国際公開番号】WO2020/023923

【公表番号】特表2021-530541(P2021-530541A)

【公表日】令和3年11月11日(2021.11.11)

【出願番号】特願2021-503108(P2021-503108)

【国際特許分類】

C 07 C 211/29(2006.01)

10

A 61 P 25/08(2006.01)

A 61 K 31/137(2006.01)

C 07 C 219/14(2006.01)

【F I】

C 07 C 211/29 C S P

A 61 P 25/08

A 61 K 31/137

C 07 C 219/14

【手続補正書】

20

【提出日】令和4年7月25日(2022.7.25)

【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】

化合物と1以上の薬学的に許容できる賦形剤とを含む医薬組成物であって、

前記化合物は、(R)-フェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩、(R)-ノルフェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩、及び(R)-ベンフルオレクス又はその薬学的に許容できる塩から選択され、

前記化合物は80%超の鏡像体過剰率(ee)を有する医薬組成物。

【請求項2】

前記化合物が90%超のeeを有する請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記化合物が95%超のeeを有する請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記化合物が97%超のeeを有する請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記化合物が99%超のeeを有する請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記化合物が80%~99%のeeを有する請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項7】

前記化合物が90%~99%のeeを有する請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項8】

前記化合物が(R)-フェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩である請求項1から請求項7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項9】

前記組成物が、30mg超の(R)-フェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩

50

を含む請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 1 0】

前記組成物が、35mg超の(R)-フェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩を含む請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 1 1】

前記組成物が、40mg超の(R)-フェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩を含む請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記組成物が、40mg~300mgの(R)-フェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩を含む請求項8に記載の医薬組成物。

10

【請求項 1 3】

前記組成物が、40mg~150mgの(R)-フェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩を含む請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

前記化合物が(R)-ノルフェンフルラミン又はその薬学的に許容できる塩である請求項1から請求項7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

前記化合物が(R)-ベンフルオレクス又はその薬学的に許容できる塩である請求項1から請求項7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

20

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0180

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0180】

結果。動物をランダムにビヒクル群($n = 16$)又は異なる用量の群(1用量あたり $n = 16$)に割り当て、処置条件を知らない実験者によって上記6Hzアッセイを実施した。(rac)-フェンフルラミン及び(R)-フェンフルラミンは、20mg/kgで動物に投与したとき、ともに、精神運動性の発作に対して保護されるマウスの百分率において同様の傾向を示した(図1)。(rac)-フェンフルラミンによって保護された動物の百分率は37.5%(フィッシャーの直接確率検定によると $p = 0.018$)であり、(R)-フェンフルラミンによって保護された動物の百分率は31.3%($p = 0.043$)であり、ビヒクルのみ(対照)によって保護された動物の百分率は0%であった。同様に、20mg/kgで(rac)-ノルフェンフルラミン及び(R)-ノルフェンフルラミンを動物に投与したところ、精神運動性の発作に対する同様の保護レベルが示された(図1)。(rac)-ノルフェンフルラミンによって保護された動物の百分率は50%(フィッシャーの直接確率検定によると $p = 0.002$)であり、(R)-ノルフェンフルラミンによって保護された動物の百分率は50%($p = 0.002$)であり、ビヒクルのみ(対照)によって保護された動物の百分率は0%であった。

30

40

50