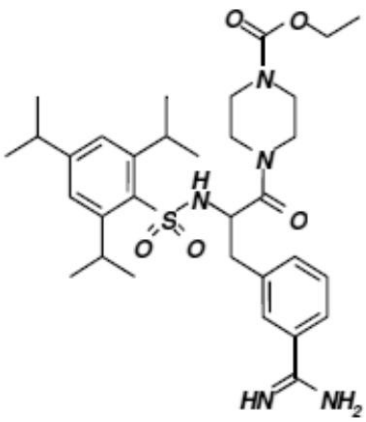
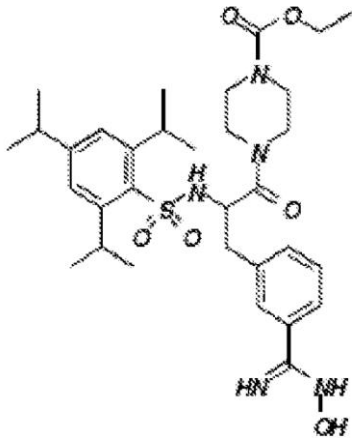
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和3年8月12日(2021.8.12)

【公表番号】特表2020-527582(P2020-527582A)
【公表日】令和2年9月10日(2020.9.10)
【年通号数】公開・登録公報2020-037
【出願番号】特願2020-502586(P2020-502586)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/495　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/12　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　1/18　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　45/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　29/00　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/495
Ａ６１Ｐ　1/10
Ａ６１Ｐ　1/12
Ａ６１Ｐ　1/04
Ａ６１Ｐ　1/18
Ａ６１Ｋ　45/00
Ａ６１Ｐ　43/00　１２１
Ａ６１Ｐ　29/00

【手続補正書】
【提出日】令和3年7月5日(2021.7.5)
【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】
過敏性腸症候群を治療するための医薬であって、
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－アミジノ－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド

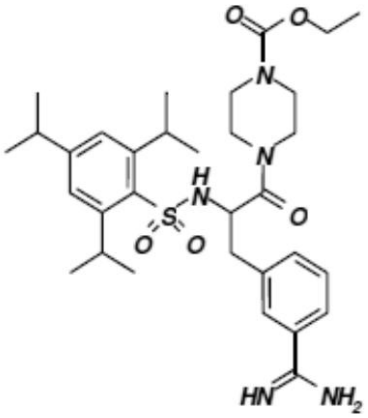


又は
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド

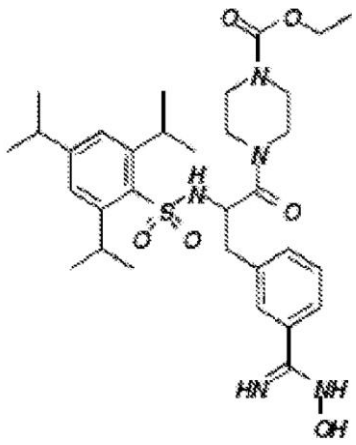


又は
その立体異性体、ラセミ混合物、代謝産物、薬学的に許容される塩、結晶、又はそれらの任意の組み合わせ
である化合物を含む、医薬。
【請求項２】
前記化合物が、経口投与可能な形態である、請求項１に記載の医薬。
【請求項３】
前記化合物が、注入用に製剤化されている、請求項１に記載の医薬。
【請求項４】
前記過敏性腸症候群が、下痢を伴う過敏性腸症候群である、請求項１～３のいずれか１項に記載の医薬。
【請求項５】
前記過敏性腸症候群が、便秘を伴う過敏性腸症候群である、請求項１～３のいずれか１項に記載の医薬。
【請求項６】
前記化合物が、Ｌ－エナンチオマー立体配座を有する、請求項１～５のいずれか１項に記載の医薬。
【請求項７】
前記化合物が、Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミノ－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、その立体異性体、ラセミ混合物、代謝産物、薬学的に許容される塩、結晶、又はそれらの組み合わせである、請求項１～６のいずれか１項に記載の医薬。
【請求項８】

前記化合物が、硫酸塩又は硫酸水素塩として存在する、請求項１～７のいずれか１項に記載の医薬。
【請求項９】
前記化合物が、
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミノ－（Ｄ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、及び
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｄ，Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド
又はそれらの生理学的に適合性の塩からなる群から選択される、請求項１～８のいずれか１項に記載の医薬。
【請求項１０】
前記化合物が、Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド硫酸水素塩である、請求項１～９のいずれか１項に記載の医薬。
【請求項１１】
前記化合物が、Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド又はその生理学的に適合性の塩の結晶形態である、請求項１～１０のいずれか１項に記載の医薬。
【請求項１２】
前記過敏性腸症候群を治療するための医薬組成物であって、
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－アミジノ－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド



又は
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド



又は
その立体異性体、ラセミ混合物、代謝産物、薬学的に許容される塩、結晶、又はそれらの任意の組み合わせと、
薬学的に許容可能な担体を含む、
医薬組成物。
【請求項１３】
前記化合物が、経口投与可能な形態である、請求項１２に記載の医薬組成物。
【請求項１４】
前記化合物が、注入用に製剤化されている、請求項１２に記載の医薬組成物。
【請求項１５】
前記過敏性腸症候群が、下痢を伴う過敏性腸症候群である、請求項１２～１４のいずれか１項に記載の医薬組成物。
【請求項１６】
前記過敏性腸症候群が、便秘を伴う過敏性腸症候群である、請求項１２～１４のいずれか１項に記載の医薬組成物。
【請求項１７】
前記化合物が、Ｌ－エナンチオマー立体配座を有する、請求項１２～１６のいずれか１項に記載の医薬組成物。
【請求項１８】
前記化合物が、Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミノ－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、その立体異性体、ラセミ混合物、代謝産物、薬学的に許容される塩、結晶、又はそれらの組み合わせである、請求項１２～１７のいずれか１項に記載の医薬組成物。
【請求項１９】
前記化合物が、硫酸塩又は硫酸水素塩として存在する、請求項１２～１８のいずれか１項に記載の医薬組成物。
【請求項２０】
前記化合物が、
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミノ－（Ｄ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、及び
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｄ，Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド
又はそれらの生理学的に適合性の塩からなる群から選択される、
請求項１２～１９のいずれか１項に記載の医薬組成物。
【請求項２１】
前記化合物が、Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－

ヒドロキシアミジノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド硫酸水素塩である、請求項１２～２０のいずれか１項に記載の医薬組成物。
【請求項２２】
前記化合物が、Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド又はその生理学的に適合性の塩の結晶形態である、請求項１２～２１のいずれか１項に記載の医薬組成物。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９５
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９５】
当業者であれば、広範に記載される本発明の範囲から逸脱することなく、特定の実施形態に示されるように、多数の変形及び／又は修正が本発明になされ得ることが理解されるであろう。したがって、本実施形態は、全ての点で限定的ではなく、例示的なものとして考慮されるべきである。
本発明は、以下の実施態様を含む。
１．　非癌性医学的状態を有する動物から生体試料を得ることと、
前記試料を試験して、トリプシン濃度を得ることと、を含み、前記トリプシン濃度が正常性の上限を上回る場合、前記動物が、薬学的に許容可能な担体と、化合物Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、立体異性体、ラセミ混合物、代謝産物、薬学的に許容される塩、結晶、又はこれらの任意の組み合わせと、を含む治療有効量の医薬組成物を前記動物に投与することによって、適切な期間治療される、方法。
２．　前記生体試料が、血液、血清、尿、唾液、十二指腸液、及び腸粘膜生検からなる群から選択される、項目１に記載の方法。
３．　前記非癌性医学的状態が、膵炎、胃炎、過敏性腸症候群、及び炎症性腸疾患からなる群から選択される、項目１に記載の方法。
４．　前記非癌性医学的状態が、過敏性腸症候群である、項目３に記載の方法。
５．　前記過敏性腸症候群が、便秘優位型の過敏性腸症候群である、項目４に記載の方法。
６．　前記過敏性腸症候群が、下痢優位型の過敏性腸症候群である、項目４に記載の方法。
７．　前記非癌性医学的状態が、炎症性腸疾患である、項目３に記載の方法。
８．　前記炎症性腸疾患が、クローン病である、項目７に記載の方法。
９．　前記炎症性腸疾患が、潰瘍性大腸炎である、項目７に記載の方法。
１０．　前記非癌性医学的状態が、急性膵炎である、項目１に記載の方法。
１１．　前記医薬組成物が、経口投与可能な形態である、項目１に記載の方法。
１２．　前記化合物が、硫酸塩又は硫酸水素塩として存在する、項目１に記載の方法。
１３．　前記化合物が、
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｌ）－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｄ）－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、及び
Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｄ，Ｌ）－フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド、
又はその生理学的に適合性の塩からなる群から選択される、項目１に記載の方法。
１４．　前記化合物が、Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジ

ド硫酸水素塩である、項目１３に記載の方法。
１５．　前記化合物が、Ｎ－α－（２，４，６トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド又はその生理学的に適合性の塩の結晶形態である、項目１３に記載の方法。
１６．　前記動物が、ヒトである、項目１に記載の方法。
１７．　前記生体試料を試験して、トリプシン－３のレベルを得る、項目１に記載の方法。
１８．　前記生体試料を試験して、トリプシン－２のレベルを得る、項目１に記載の方法。
１９．　前記医薬組成物が、前記非癌性医学的状態の治療のために承認された別の薬剤と同時投与される、項目１に記載の方法。
２０．　過敏性腸症候群を有するヒトから十二指腸流体の生体試料を得ることと、
前記試料を試験して、トリプシン－３濃度を得ることと、を含み、前記トリプシン－３濃度が正常性の上限を上回る場合、前記ヒトが、薬学的に許容可能な担体と、化合物Ｎ－α－（２，４，６－トリイソプロピルフェニルスルホニル）－３－ヒドロキシアミジノ－（Ｌ）フェニルアラニン－４－エトキシカルボニルピペラジド硫酸水素塩と、を含む治療有効量の医薬組成物を前記ヒトに投与することによって、適切な期間治療される、方法。