

【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24日(2022.8.24)

【国際公開番号】WO2020/041574

【公表番号】特表2021-535106(P2021-535106A)

【公表日】令和3年12月16日(2021.12.16)

【出願番号】特願2021-509210(P2021-509210)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/437(2006.01)

A 6 1 P 1/04(2006.01)

A 6 1 P 1/14(2006.01)

A 6 1 P 7/06(2006.01)

A 6 1 P 1/10(2006.01)

A 6 1 P 29/00(2006.01)

A 6 1 P 19/02(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 31/437

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 1/10

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 19/02

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年8月16日(2022.8.16)

【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

30

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

約0.05mg～約30mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む、クローン病、セリアック病、潰瘍性大腸炎、顕微鏡的大腸炎および過敏性腸症候群からなる群より選択される消化管障害を処置するための医薬であって、患者の消化管障害の1つ以上の症状の改善を提供する、医薬。

【請求項2】

改善が、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超提供される、請求項1に記載の医薬。

40

【請求項3】

約1mg～約15mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む、請求項1または2に記載の医薬。

【請求項4】

ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のインピボ血漿プロファイルを、50%超低下させる、請求項1～3のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項5】

ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のAUC<sub>6-12</sub>が、投与量の75%未満である、請求項1～4のいずれか一項に記載の医薬。

50

## 【請求項 6】

消化管障害が過敏性腸症候群であり、医薬が、痙攣、繰り返しの腹痛、腹部膨満、下痢および便秘からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、請求項1～5のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 7】

消化管障害がクローン病であり、医薬が、下痢、痙攣、腹痛、貧血、発熱および悪心からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、請求項1～5のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 8】

消化管障害がセリアック病であり、医薬が、腹部膨満、慢性の下痢、便秘、ガス、悪心、蒼白い顔色、悪臭のする便、胃痛および栄養素の吸収不良、思春期の遅延、乳児の成長障害、成長の遅延および体重減少からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、請求項1～5のいずれか一項に記載の医薬。

10

## 【請求項 9】

消化管障害が潰瘍性大腸炎であり、医薬が、排便の緊急の必要性、血性排便、発熱、重度の腹部痙攣、倦怠感、悪心、食欲不振、体重減少、貧血、関節痛および発疹からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、請求項1～5のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 10】

消化管障害が顕微鏡的大腸炎であり、医薬が、慢性の水様性非血性下痢、排便をすることへの強い切迫感、疼痛、痙攣、腹部膨満、体重減少、悪心および便失禁からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、請求項1～5のいずれか一項に記載の医薬。

20

## 【請求項 11】

少なくとも12時間の患者の改善を提供する、請求項3～10のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 12】

約400ng/ml未満の $C_{max}$ を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、請求項1～11のいずれか一項に記載の医薬。

30

## 【請求項 13】

約900ng・時間/ml未満の $AUC_{6-12}$ を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、請求項1～12のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 14】

約0.05mg～約30mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む、喘息を処置するための医薬であって、患者の喘息の1つ以上の症状の改善を提供する、医薬。

## 【請求項 15】

改善が、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超提供される、請求項14に記載の医薬。

40

## 【請求項 16】

約1mg～約15mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む、請求項14または15に記載の医薬。

## 【請求項 17】

ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のインビボ血漿プロファイルを、50%超低下させる、請求項14～16のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 18】

ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者の $AUC_{6-12}$ が、投与量の75%未満である、請求項14～17のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 19】

50

喘鳴、胸部圧迫感、息切れおよび咳からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、請求項14～18のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項20】

少なくとも12時間の患者の改善を提供する、請求項16～19のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項21】

約400ng/ml未満の $C_{max}$ を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、請求項14～20のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項22】

約900ng・時間/ml未満の $AUC_{6-12}$ を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、請求項14～21のいずれか一項に記載の医薬。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0217

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0217】

当業者は、本明細書に記載の特定の実施態様の多くの等価物を認識するかまたはルーチンの実験のみを用いて確かめることができるだろう。当該等価物は、特許請求の範囲に包含されることが意図される。

本発明は、以下の態様および実施態様を含む。

[1] 約0.05mg～約30mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、過敏性腸症候群を処置する方法であって、患者の過敏性腸症候群の1つ以上の症状の改善を提供する、方法。

[2] 改善が、投与後6時間超提供される、[1]に記載の方法。

[3] 患者が、約1mg～約15mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む組成物を投与される、[1]に記載の方法。

[4] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のインビボ血漿プロファイルを、50%超低下させる、[1]に記載の方法。

[5] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者の $AUC_{6-12}$ が、投与量の75%未満である、[1]に記載の方法。

[6] 方法が、痙攣、繰り返しの腹痛、腹部膨満、下痢および便秘からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、[1]に記載の方法。

[7] 組成物が、少なくとも12時間の患者の改善を提供する、[2]に記載の方法。

[8] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、過敏性腸症候群を処置する方法であって、約400ng/ml未満の $C_{max}$ を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。

[9] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、過敏性腸症候群を処置する方法であって、約900ng・時間/ml未満の $AUC_{6-12}$ を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。

[10] 約0.05mg～約30mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、クローン病を処置する方法であって、患者のクローン病の1つ以上の症状の改善を提供する、方法。

[11] 改善が、投与後6時間超提供される、[10]に記載の方法。

[12] 患者が、約1mg～約15mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む組成物を投与される、[10]に記載の方法。

10

20

30

40

50

- [13] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のインビボ血漿プロファイルを、50%超低下させる、[10]に記載の方法。
- [14] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のAUC<sub>6-12</sub>が、投与量の75%未満である、[10]に記載の方法。
- [15] 方法が、下痢、痙攣、腹痛、貧血、発熱および悪心からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、[10]に記載の方法。
- [16] 組成物が、少なくとも12時間の患者の改善を提供する、[11]に記載の方法。
- [17] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、クローン病を処置する方法であって、約400ng/ml未満のC<sub>max</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。 10
- [18] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、クローン病を処置する方法であって、約900ng・時間/ml未満のAUC<sub>6-12</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。
- [19] 約0.05mg~約30mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、セリアック病を処置する方法であって、患者のセリアック病の1つ以上の症状の改善を提供する、方法。
- [20] 改善が、投与後6時間超提供される、[19]に記載の方法。
- [21] 患者が、約1mg~約15mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む組成物を投与される、[19]に記載の方法。 20
- [22] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のインビボ血漿プロファイルを、50%超低下させる、[19]に記載の方法。
- [23] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のAUC<sub>6-12</sub>が、投与量の75%未満である、[19]に記載の方法。
- [24] 方法が、腹部膨満、慢性の下痢、便秘、ガス、悪心、蒼白い顔色、悪臭のする便、胃痛および栄養素の吸収不良、思春期の遅延、乳児の成長障害、成長の遅延および体重減少からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、[19]に記載の方法。
- [25] 組成物が、少なくとも12時間の患者の改善を提供する、[20]に記載の方法。 30
- [26] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、セリアック病を処置する方法であって、約400ng/ml未満のC<sub>max</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。
- [27] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、セリアック病を処置する方法であって、約900ng・時間/ml未満のAUC<sub>6-12</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。
- [28] 約0.05mg~約30mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、潰瘍性大腸炎を処置する方法であって、患者の潰瘍性大腸炎の1つ以上の症状の改善を提供する、方法。 40
- [29] 改善が、投与後6時間超提供される、[28]に記載の方法。
- [30] 患者が、約1mg~約15mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む組成物を投与される、[28]に記載の方法。
- [31] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のインビボ血漿プロファイルを、50%超低下させる、[28]に記載の方法。
- [32] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のAUC<sub>6-12</sub>が、投与量の75%未満である、[28]に記載の方法。
- [33] 方法が、排便の緊急の必要性、血性排便、発熱、重度の腹部痙攣、倦怠感、悪心、食欲不振、体重減少、貧血、関節痛および発疹からなる群より選択される少なくとも1 50

つの症状の改善を提供する、[28]に記載の方法。

[34] 組成物が、少なくとも12時間の患者の改善を提供する、[29]に記載の方法。

[35] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、セリアック病を処置する方法であって、約400ng/ml未満のC<sub>max</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。

[36] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、セリアック病を処置する方法であって、約900ng・時間/ml未満のAUC<sub>6-12</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。

10

[37] 約0.05mg~約30mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、顕微鏡的大腸炎を処置する方法であって、患者の顕微鏡的大腸炎の1つ以上の症状の改善を提供する、方法。

[38] 改善が、投与後6時間超提供される、[37]に記載の方法。

[39] 患者が、約1mg~約15mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む組成物を投与される、[37]に記載の方法。

[40] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のインビボ血漿プロファイルを、50%超低下させる、[37]に記載の方法。

[41] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のAUC<sub>6-12</sub>が、投与量の75%未満である、[37]に記載の方法。

20

[42] 方法が、慢性の水様性非血性下痢、排便をすることへの強い切迫感、疼痛、痙攣、腹部膨満、体重減少、悪心および便失禁からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、[37]に記載の方法。

[43] 組成物が、少なくとも12時間の患者の改善を提供する、[38]に記載の方法。

[44] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、顕微鏡的大腸炎を処置する方法であって、約400ng/ml未満のC<sub>max</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。

[45] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、顕微鏡的大腸炎を処置する方法であって、約900ng・時間/ml未満のAUC<sub>6-12</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。

30

[46] 約0.05mg~約30mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、喘息を処置する方法であって、患者の喘息の1つ以上の症状の改善を提供する、方法。

[47] 改善が、投与後6時間超提供される、[46]に記載の方法。

[48] 患者が、約1mg~約15mgのガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を含む組成物を投与される、[46]に記載の方法。

[49] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のインビボ血漿プロファイルを、50%超低下させる、[46]に記載の方法。

40

[50] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与6時間後の患者のAUC<sub>6-12</sub>が、投与量の75%未満である、[46]に記載の方法。

[51] 方法が、喘鳴、胸部圧迫感、息切れおよび咳からなる群より選択される少なくとも1つの症状の改善を提供する、[46]に記載の方法。

[52] 組成物が、少なくとも12時間の患者の改善を提供する、[47]に記載の方法。

[53] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投与することを含む、喘息を処置する方法であって、約400ng/ml未満のC<sub>max</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。

[54] ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩を、処置を必要とする患者に投

50

与することを含む、喘息を処置する方法であって、約900ng・時間/ml未満のAUC<sub>6-12</sub>を含むインビボ血漿プロファイルを提供し、ガボキサドールまたはその医薬的に許容される塩の投与後6時間超の患者の改善を提供する、方法。

10

20

30

40

50