

【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1月6日(2022.1.6)

【公表番号】特表2021-504370(P2021-504370A)  
 【公表日】令和3年2月15日(2021.2.15)  
 【年通号数】公開・登録公報2021-007  
 【出願番号】特願2020-528867(P2020-528867)  
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/439 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/06 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/54 (2017.01)  
 A 6 1 K 9/20 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/48 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/439  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 3/06  
 A 6 1 K 47/54  
 A 6 1 K 9/20  
 A 6 1 K 9/48  
 A 6 1 K 9/08  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和3年11月25日(2021.11.25)

【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】

ファルネソイドX受容体(FXR)によって媒介される肝疾患又は肝障害を治療又は予防するための、トロピフェキソールを含む医薬組成物であって、トロピフェキソールが約140 $\mu$ g～約250 $\mu$ gの範囲の用量で投与される、医薬組成物。

【請求項2】

前記肝疾患が慢性肝疾患である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記慢性肝疾患が、非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、薬剤誘発性胆管損傷、胆石、肝硬変、アルコール誘発性肝硬変、嚢胞性線維症、胆管閉塞、胆石症又は肝線維症である、請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記用量が、1日量である、請求項1～3のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記用量が、1日2回用量である、請求項1～3のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記用量が、2日ごとに投与されるべきである、請求項1～3のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項7】

トロピフェキソールが、その遊離形態又はアミノ酸コンジュゲートである、請求項1～6のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項8】

約140 $\mu$ g、約150 $\mu$ g、約160 $\mu$ g、約170 $\mu$ g、約180 $\mu$ g、約190 $\mu$ g、約200 $\mu$ g、約210 $\mu$ g、約220 $\mu$ g、約230 $\mu$ g、約240 $\mu$ g又は約250 $\mu$ gの、最大で約500 $\mu$ g/日の最大総用量の経口投与に適したトロピフェキソールを含む、単位剤形医薬組成物。

【請求項9】

液体、錠剤、カプセル剤から選択される形態における、請求項8に記載の単位剤形医薬組成物。

【請求項10】

慢性肝疾患の治療のための、請求項8又は9に記載の単位剤形医薬組成物。

【請求項11】

前記慢性肝疾患が、非アルコール性脂肪性肝疾患（NAFLD）、非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）、薬剤誘発性胆管損傷、胆石、肝硬変、アルコール誘発性肝硬変、嚢胞性線維症、胆管閉塞、胆石症、又は肝線維症である、請求項10に記載の単位剤形医薬組成物。

【請求項12】

非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）の治療のための、請求項11に記載の単位剤形医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0117

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0117】

本明細書に記載の実施例及び実施形態があくまで例示的であり、且つ当業者にそれを考慮した様々な修飾又は変更が示唆されることになり、本願の精神及び範囲、並びに貼付の特許請求の範囲の範囲内に含まれるべきであることは理解される。本明細書中に引用されるすべての出版物、特許、及び特許出願は、あらゆる目的でここで参照により援用される。

本発明は次の実施態様を含む。

[1]

ファルネソイドX受容体（FXR）によって媒介される状態、例えば肝疾患又は障害を治療又は予防するための薬剤の製造における、約140 $\mu$ g～約250 $\mu$ gの範囲内の用量で投与される、トロピフェキソールの使用。

[2]

前記疾患が、慢性肝疾患、例えば、非アルコール性脂肪性肝疾患（NAFLD）、非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）、薬剤誘発性胆管損傷、胆石、肝硬変、アルコール誘発性肝硬変、嚢胞性線維症、胆管閉塞、胆石症、肝線維症である、上記[1]に記載の使用。

[3]

前記用量が、1日量である、上記[1]又は[2]に記載の使用。

[4]

前記用量が、1日2回用量である、上記[1]又は[2]に記載の使用。

[ 5 ]

前記用量が、2日ごとに投与される、上記[ 1 ]又は[ 2 ]に記載の使用。

[ 6 ]

トロピフェキソールが、その遊離形態又はアミノ酸コンジュゲートである、上記[ 1 ]～[ 5 ]のいずれかに記載の使用。

[ 7 ]

約140 $\mu$ g、約150 $\mu$ g、約160 $\mu$ g、約170 $\mu$ g、約180 $\mu$ g、約190 $\mu$ g、約200 $\mu$ g、約210 $\mu$ g、約220 $\mu$ g、約230 $\mu$ g、約240 $\mu$ g又は約250 $\mu$ gの、最大で約500 $\mu$ g/日の最大総用量の経口投与に適したトロピフェキソールを含む、単位剤形医薬組成物。

[ 8 ]

液体、錠剤、カプセル剤から選択される形態における、上記[ 7 ]に記載の単位剤形医薬組成物。

[ 9 ]

慢性肝疾患、例えば、非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、薬剤誘発性胆管損傷、胆石、肝硬変、アルコール誘発性肝硬変、嚢胞性線維症、胆管閉塞、胆石症、肝線維症の治療における使用を意図した、上記[ 7 ]又は[ 8 ]に記載の単位剤形医薬組成物。

[ 10 ]

非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)の治療における使用を意図した、上記[ 9 ]に記載の単位剤形医薬組成物。