

【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2月15日(2022.2.15)

【国際公開番号】WO2019/154899
 【公表番号】特表2021-513507(P2021-513507A)
 【公表日】令和3年5月27日(2021.5.27)
 【出願番号】特願2020-538823(P2020-538823)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 3 1 / 5 6 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

A 6 1 K 3 1 / 5 6 5

A 6 1 P 7 / 0 2

10

【手続補正書】

【提出日】令和4年2月4日(2022.2.4)

【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】

エストロゲン成分として有効量のエストロール成分、及びプロゲステゲン成分として有効量のドロスピレノンを含む、雌哺乳動物用の複合ホルモン避妊薬。

【請求項2】

エストロゲン成分として有効量のエストロール成分を含む、雌哺乳動物における避妊用組成物であって、前記エストロール成分が、プロゲステゲン成分としてのドロスピレノンと組み合わせて使用することを特徴とする、組成物。

【請求項3】

雌哺乳動物用避妊薬の製造のための組成物の使用であって、前記組成物が、エストロゲン成分として有効量のエストロール成分、及びプロゲステゲン成分として有効量のドロスピレノンを含む、使用。

【請求項4】

他の避妊方法と比較して、静脈血栓塞栓症(VTE)イベントの数、頻度及び/又は重症度が低減される、請求項1の避妊薬、請求項2の組成物、又は請求項3の使用。

【請求項5】

VTEリスクが、第2世代COCに関連するVTEリスクと類似している、請求項1～4のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項6】

VTEリスクが、レボノルゲステレル、ノルゲステメート又はノルエチステロンに基づくCOC、好ましくはレボノルゲステレルに基づくCOCの使用中のVTEのリスクと類似している、請求項1～5のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項7】

VTEの症例数が、1年間に女性10,000人当たり10人未満、好ましくは8人未満、より好ましくは7人未満、さらに好ましくは6人未満、さらに好ましくは5人未満、さらにいっそう好ましくは4人未満である、請求項1～6のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項8】

20

30

40

50

前記エストロール成分が1日用量1mg～40mg、好ましくは1日用量5mg～25mg、より好ましくは1日用量10mg～20mg、さらに好ましくは1日用量約15mgで使用される、請求項1～7のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項9】

ドロスピレノンが1日用量0.5mg～10mg、好ましくは1日用量1mg～4mg、より好ましくは1日用量約3mgで使用される、請求項1～8のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項10】

前記避妊薬又は組成物が、約7日の無投与間隔、好ましくは約4日の無投与間隔を有する併用法により投与されるためのものである、請求項1～9のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

10

【請求項11】

前記エストロール成分がエストロール、好ましくはエストロール水和物である、請求項1～10のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項12】

エストロールが1日用量約15mgのエストロールで使用される、請求項1～11のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項13】

ドロスピレノンが1日用量約3mgで使用される、請求項12に記載の避妊薬、組成物又は使用。

20

【請求項14】

前記避妊薬又は組成物が経口投与単位として製剤化され、好ましくは前記投与単位が1日投与単位に対応するように製剤化されている、請求項1～13のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項15】

止血変化が、第2、第3又は第4世代のCOCに関連する止血変化よりも小さく、好ましくは、第2世代のCOCに関連する止血変化よりも小さい、請求項1～14のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項16】

VTEリスクが、第3世代又は第4世代のCOCに関連するVTEリスクよりも低く、好ましくは、第2世代のCOCに関連するVTEリスクよりも低く、より好ましくは、レボノルゲストレル、ノルゲステマト又はノルエチステロンに基づくCOCに関連するVTEリスクよりも低く、さらに好ましくは、ノルゲステマトに基づくCOCに関連するVTEリスクよりも低い、請求項1～15のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

30

【請求項17】

VTE以外の副作用のプロファイルが、第2世代COCに関連する副作用のプロファイルよりも良好である、請求項1～16のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項18】

前記避妊薬又は組成物が、初めての使用者である女性、又は4週間を超える中断を有する移行者又は再開者である女性、又は30を超えるBMI、高齢、及び陽性の個人歴及び/又は家族歴から選択される1つ又は複数の主要な危険因子のためにVTEのベースラインリスクが増加している女性に投与されるためのものである、請求項1～17のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

40

【請求項19】

COCを使用しない女性と比較して、相対的なVTEリスクが3.5未満、好ましくは3.2未満、より好ましくは3.0未満、さらにいっそう好ましくは2.5未満、さらになおいっそう好ましくは2.0未満である、請求項1～18のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

【請求項20】

50

COCを使用していない対象と比較して血栓症リスクに対するオッズ比が2以上である対象として定義される血栓症の高リスクカテゴリーの対象の割合が、前記組成物を使用している全集団の40%未満、好ましくは35%未満、より好ましくは30%未満、さらにいっそう好ましくは25%未満、さらになおいっそう好ましくは20%未満を表す、請求項1～19のいずれか一項に記載の避妊薬、組成物又は使用。

10

20

30

40

50