

【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】平成31年2月21日 (2019.2.21)

【公表番号】特表2018-502126(P2018-502126A)

【公表日】平成30年1月25日 (2018.1.25)

【年通号数】公開・登録公報2018-003

【出願番号】特願2017-536934(P2017-536934)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/706 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 9/12

A 6 1 K 31/706

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 K 31/53

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/4025

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/422

【手続補正書】

【提出日】平成31年1月7日 (2019.1.7)

【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】

B M P R 2 シグナル伝達を増加させる化合物（B M P R 2 活性化剤）を含む、患者の肺高血圧症を治療または予防するための医薬組成物であって、肺高血圧症の状態またはそれと関連する状態の治療に有効な別の活性剤と併用される医薬組成物。

【請求項 2】

B M P R 2 活性化剤が運動能力を改善するため、臨床的悪化を遅延させるため、またはそれらの組み合わせのために使用される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

肺高血圧症が慢性閉塞性肺疾患（C O P D）、睡眠呼吸障害、肺胞性換気過少障害、高

地への慢性暴露、発生異常、近位および／もしくは遠位肺動脈の血栓塞栓性閉塞、非血栓性肺塞栓症、サルコイドーシス、ヒスチオサイトーシスX、リンパ管腫症、または肺血管の圧迫の1つ以上と関連している、請求項1 または2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

肺高血圧症が肺動脈高血圧症（PAH）である、請求項1 または2に記載の医薬組成物。

【請求項5】

患者が（a）肺高血圧症の状態の改善を示す1つ以上の血行動態パラメーターのベースラインに対するより正常なレベルへの調整；（b）ベースラインに対する運動能力の増加；（c）ベースラインに対するBorg呼吸困難指数（BDI）の低下；（d）ベースラインに対する1つ以上のクオリティ・オブ・ライフパラメーターの改善；（e）より低いWHO機能分類への移動；および（f）ベースラインに対する血漿ナトリウム利尿ペプチドレベルの減少の少なくとも1つを経験する、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項6】

BMPR2活性化剤がタクロリムスまたはその医薬的に許容される溶媒和物もしくは塩である、請求項1～5のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項7】

1日用量が約0.02 ng/mL～約10 ng/mLの血清濃度を提供する、請求項1～6のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項8】

1日用量が約0.1 ng/mL～約5 ng/mLの血清濃度を提供する、請求項7に記載の医薬組成物。

【請求項9】

1日用量が約0.1 ng/mL～約4 ng/mLの血清濃度を提供する、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項10】

第2の活性剤がホスホジエステラーゼ（PDE）阻害剤、エンドセリン受容体アンタゴニスト、プロスタノイド、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、カルシウムチャネル遮断薬、利尿剤、抗凝血剤、酸素、およびそれらの組み合わせからなる群から選択される少なくとも1つの薬物を含む、請求項1～9のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項11】

PDE5阻害剤がアバナフィル、ロデナフィル、ミロデナフィル、シルデナフィル、タダラフィル、バルデナフィル（verdenafil）、ウデナフィル、ザプリナスト、ザプリナスト、またはそれらの組み合わせである、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項12】

エンドセリンアンタゴニストがアンブリセンタン、アトラセンタン、ボセンタン、マシテンタン、ジボテンタン（sibotentan）、シタクセンタン、テゾセンタン、またはそれらの組み合わせである、請求項10 または11に記載の医薬組成物。

【請求項13】

グアニル酸シクラーゼ活性化剤がリオシグアトである、請求項10～12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項14】

タクロリムスまたはその医薬的に許容される溶媒和物もしくは塩を含む、患者の肺動脈高血圧症を治療または予防するための医薬組成物であって、肺高血圧症の状態またはそれと関連する状態の治療に有効な別の活性剤と併用される医薬組成物。

【請求項15】

第2の活性剤がホスホジエステラーゼ（PDE）阻害剤、エンドセリン受容体アンタゴニスト、プロスタノイド、グアニル酸シクラーゼ活性化剤、カルシウムチャネル遮断薬、利尿剤、抗凝血剤、酸素、およびそれらの組み合わせからなる群から選択される少なくと

も 1 つの薬物を含む、請求項 1 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

P D E 5 阻害剤がアバナフィル、ロデナフィル、ミロデナフィル、シルデナフィル、タダラフィル、バルデナフィル (v e r d e n a f i l)、ウデナフィル、ザプリナスト、ザプリナスト、またはそれらの組み合わせである、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

P D E 5 阻害剤がアバナフィル、ウデナフィル、またはその医薬的に許容される溶媒和物もしくは塩である、請求項 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

P D E 5 阻害剤がアバナフィルまたはその医薬的に許容される溶媒和物もしくは塩である、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

B M P R 2 シグナル伝達を増加させる化合物 (B M P R 2 活性化剤) を含む、患者の肺高血圧症を治療するための医薬組成物。

【請求項 2 0】

B M P R 2 活性化剤が運動能力を改善するため、臨床的悪化を遅延させるため、またはそれらの組み合わせのために使用される、請求項 1 9 に記載の医薬組成物。