

【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 7 月 26 日 (2021.7.26)

【公表番号】特表 2020-523334 (P2020-523334A)

【公表日】令和 2 年 8 月 6 日 (2020.8.6)

【年通号数】公開・登録公報 2020-031

【出願番号】特願 2019-568107 (P2019-568107)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 7/12

A 6 1 P 13/12

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 6 月 3 日 (2021.6.3)

【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】

有効成分としてビベグロンを含む過活動膀胱の治療用医薬組成物であって、第 1 の期間のビベグロン / 日の第 1 の投薬量と、その後のビベグロン / 日の第 2 の投薬量とを、それを必要とする対象に経口的に投与するためのものであって、前記第 2 の投薬量は、前記第 1 の投薬量よりも多い医薬組成物。

【請求項 2】

前記対象がヒトである請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記第 1 の投薬量が 50 mg ~ 75 mg / 日である請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記第 1 の投薬量が 50 mg / 日である請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記第 2 の投薬量が 75 mg から 100 mg / 日である請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記第 2 の投薬量が 100 mg / 日である請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記第 1 の投薬量が 50 mg / 日であり、且つ、前記第 2 の投薬量が 100 mg / 日である請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記第 1 の期間が 1 週から 1 2 週である請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記第 1 の期間が 8 週である請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記過活動膀胱の治療が、切迫性尿失禁（UUI）、尿意切迫感、頻尿、夜間頻尿又はその組み合わせからなる群から選択される 1 以上の症状を治療である請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記 1 以上の症状が、切迫性尿失禁（UUI）、尿意切迫感又は頻尿である請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記対象が、女性のヒトである請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記対象が、男性のヒトである請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記対象が、65 歳を超えているヒトである請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記対象が、重度腎機能障害を患っている請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記対象が、中等度腎機能障害を患っている請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記対象が、CYP3A/P 糖タンパク質阻害剤を同時に受けている請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

ビベグロンが、1 日に 1 回投与されるものである請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

ビベグロンが、食事と共に投与されるものである請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

ビベグロンが、食事を伴わずに投与されるものである請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

ビベグロンが、錠剤である請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記錠剤が、投与前に粉碎されるものである請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

ビベグロンが、その薬学的に許容し得る塩として投与されるものである請求項 1 ~ 22 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

第 1 の投薬量及び / 又は第 2 の投薬量が、 0 ng/mL から 313 ng/mL のビベグロンの定常状態 C_{max} を提供するものである請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

第 1 の投薬量及び / 又は第 2 の投薬量が、 $331 \text{ ng} \cdot \text{hr/mL}$ から $3613 \text{ ng} \cdot \text{hr/mL}$ のビベグロンの定常状態 AUC を提供するものである請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

第 1 の投薬量及び / 又は第 2 の投薬量が、0.5 時間から 6.0 時間のピベグロンの T_{max} を提供するものである請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

第 1 の投薬量及び / 又は第 2 の投薬量が、以下：

- (i) 0 ng/mL から 313 ng/mL のピベグロンの定常状態 C_{max} ；
 - (ii) $331\text{ ng}\cdot\text{hr/mL}$ から $3613\text{ ng}\cdot\text{hr/mL}$ のピベグロンの定常状態 AUC ；又は
 - (iii) 0.5 時間から 6.0 時間のピベグロンの T_{max}
- の 1 つ又は複数を提供するものである請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

ピベグロンが、4 週、3 週又は 2 週で過活動膀胱の治療において有効であるものである請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

対象が、第 2 の治療有効量のピベグロンの投与後に 2 mm/Hg 未満のベースラインからの収縮期血圧の平均変化を経験するものである請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

第 1 の治療有効量が 50 mg であり、第 2 の治療有効量が 100 mg である請求項 29 に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

対象が、第 2 の治療有効量のピベグロンの投与後に 1 mm/Hg 未満のベースラインからの拡張期血圧の平均変化を経験するものである請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

第 1 の治療有効量が 50 mg であり、第 2 の治療有効量が 100 mg である請求項 31 に記載の医薬組成物。

【請求項 33】

対象が、第 1 の治療有効量の投与後の収縮期血圧の平均変化よりも、第 2 の治療有効量の投与後の収縮期血圧の平均変化が低い請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

第 2 の治療有効量の投与後の収縮期血圧の平均変化が 1 mm/Hg 未満である請求項 33 に記載の医薬組成物。

【請求項 35】

第 1 の治療有効量が 50 mg であり、第 2 の治療有効量が 100 mg である請求項 33 に記載の医薬組成物。

【請求項 36】

対象は、治療期間にわたって、ベースラインからの緊急性尿失禁 (UUI) エピソードの平均数の変化を -1.3 から -2.5 に経験するものである請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 37】

有効成分としてピベグロンを含む膀胱平滑筋弛緩を増加させるための医薬組成物であって、第 1 の期間のピベグロン / 日の第 1 の投薬量と、その後のピベグロン / 日の第 2 の投薬量とを、それを必要とする対象に経口的に投与するためのものであって、前記第 2 の投薬量は、前記第 1 の投薬量よりも多い医薬組成物。